

PCTWELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales BüroINTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICH NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

| | | |
|--|----|--|
| (51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : | A1 | (11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 97/31904 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 4. September 1997 (04.09.97) |
| C07D 251/18, A01N 43/68, C07D 405/06, 409/12, 251/52, 405/12, 413/04 / | | |
| (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP97/00702 | | |
| (22) Internationales Anmeldedatum: 14. Februar 1997 (14.02.97) | | |
| (30) Prioritätsdaten: 196 07 450.9 28. Februar 1996 (28.02.96) DE | | (81) Bestimmungsstaaten: AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CU, CZ, EE, GE, HU, IL, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LT, LV, MD, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UZ, VN, YU, ARIPO Patent (KE, LS, MW, SD, SZ, UG), europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG). |
| (71) Anmelder: HOECHST SCHERING AGREVO GMBH [DE/DE]; Mirastrasse 54, D-13509 Berlin (DE). | | |
| (72) Erfinder: LORENZ, Klaus; Am Helgengraben 18, D-64331 Weiterstadt (DE). MINN, Klemens; Rosserstrasse 61, D- 65795 Hattersheim (DE). WILLMS, Lothar; Königsteiner Strasse 50, D-65719 Hofheim (DE). BAUER, Klaus; Doerner Strasse 53D, D-63456 Hanau (DE). BIERINGER, Hermann; Eichenweg 26, D-65817 Eppstein (DE). ROSINGER, Christopher; Am Hochfeld 33, D-65719 Hofheim (DE). | | |

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

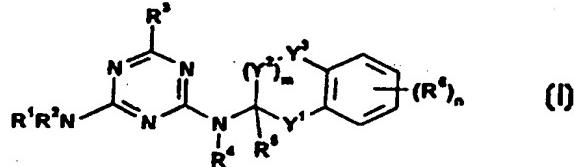
31355 U.S. PTO
10/771649

(54) Title: 2-AMINO-4-BICYCLOAMINO-1,3,5-TRIAZINES AS HERBICIDES AND PLANT GROWTH REGULATORS

(54) Bezeichnung: 2-AMINO-4-BICYCLOAMINO-1,3,5-TRIAZINE ALS HERBIZIDE UND PFLANZENWACHSTUMSREGULATOREN

(57) Abstract

The invention concerns compounds of formula (I) and their salts which are suitable as herbicides and plant growth regulators, R¹ to R⁶, Y¹, Y², Y³, m and n being defined as in claim 1. These compounds can be prepared in similar manner to known processes using intermediate products of formula (V) (cf. claim 6).



(57) Zusammenfassung

Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, worin R¹ bis R⁶, Y¹, Y², Y³, m und n wie in Anspruch 1 definiert sind, eignen sich als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren. Die Herstellung kann analog bekannten Verfahren unter Verwendung von Zwischenprodukten der Formel (V) erfolgen (vgl. Anspruch 6).

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

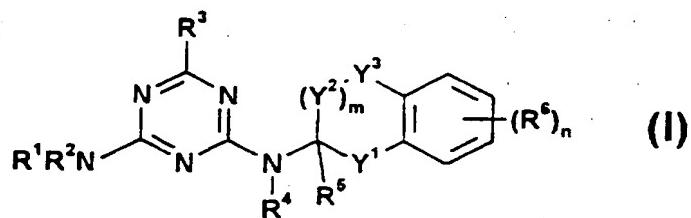
| | | | | | |
|----|--------------------------------|----|-----------------------------------|----|--------------------------------|
| AM | Armenien | GB | Vereinigtes Königreich | MX | Mexiko |
| AT | Österreich | GE | Georgien | NE | Niger |
| AU | Australien | GN | Guinea | NL | Niederlande |
| BB | Barbados | GR | Griechenland | NO | Norwegen |
| BE | Belgien | HU | Ungarn | NZ | Neuseeland |
| BF | Burkina Faso | IE | Irland | PL | Polen |
| BG | Bulgarien | IT | Italien | PT | Portugal |
| BJ | Benin | JP | Japan | RO | Rumänien |
| BR | Brasilien | KE | Kenya | RU | Russische Föderation |
| BY | Belarus | KG | Kirgisistan | SD | Sudan |
| CA | Kanada | KP | Demokratische Volksrepublik Korea | SE | Schweden |
| CF | Zentrale Afrikanische Republik | KR | Republik Korea | SG | Singapur |
| CG | Kongo | KZ | Kasachstan | SI | Slowenien |
| CH | Schweiz | LJ | Liechtenstein | SK | Slowakei |
| CI | Côte d'Ivoire | LK | Sri Lanka | SN | Senegal |
| CM | Kamerun | LR | Liberia | SZ | Swasiland |
| CN | China | LK | Litauen | TD | Tschad |
| CS | Tschechoslowakei | LU | Luxemburg | TG | Togo |
| CZ | Tschechische Republik | LV | Lettland | TJ | Tadschikistan |
| DE | Deutschland | MC | Monaco | TT | Trinidad und Tobago |
| DK | Dänemark | MD | Republik Moldau | UA | Ukraine |
| EE | Estland | MG | Madagaskar | UG | Uganda |
| ES | Spanien | ML | Mali | US | Vereinigte Staaten von Amerika |
| FI | Finnland | MN | Mongolei | UZ | Usbekistan |
| FR | Frankreich | MR | Mauretanien | VN | Vietnam |
| GA | Gabon | MW | Malawi | | |

Beschreibung**2-AMINO-4-BICYCLOAMINO-1,3,5-TRIAZINE ALS HERBIZIDE UND
PFLANZENWACHSTUMSREGULATOREN**

Die Erfindung betrifft das technische Gebiet der Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren, insbesondere der Herbizide zur selektiven Bekämpfung von Unkräutern und Ungräsern in Nutzpflanzenkulturen.

Es ist bekannt, daß 2-Amino-4-cyclohexylamino-6-perhaloalkyl-1,3,5-triazine (US-A-3816419 und US-A-3932167) oder 2-Amino-4-alkylamino-6-halogenalkyl-1,3,5-triazine (WO 90/09378 (EP-A-411153), WO 88/02368 (EP-A-283522), WO 94/24086, EP-A-509544, EP-A-492,615) herbizide und pflanzenwachstumsregulierende Eigenschaften besitzen. Die Anwendung vieler der bekannten Derivate dieses Typs als selektive Herbizide zur Schadpflanzenbekämpfung oder als Pflanzenwachstumsregulatoren in verschiedenen Nutzpflanzenkulturen erfordert häufig eine unzeitgemäße Aufwandmenge oder führt zu unerwünschten Schädigungen der Nutzpflanzen. Überraschenderweise wurden nun neue 2-Amino-4-bicycloamino-1,3,5-triazine gefunden, die vorteilhaft als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren eingesetzt werden können. Beispielsweise werden beim Einsatz der erfindungsgemäßen Verbindungen die Kulturpflanzen in vielen Fällen nicht oder in geringerem Umfang geschädigt als bei bekannten Wirkstoffen ähnlichen Typs.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Verbindungen der Formel (I) und deren Salze,



worin

R^1 und R^2 jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 10 C-Atomen, vorzugsweise mit 1 bis 6 C-Atomen, oder einen Heterocyclrest, Heterocyclxyrest, Heterocyclthiorest oder Heterocyclaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder einen Acylrest od r

R^1 und R^2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^1R^2 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 4 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom die gegebenenfalls weiteren Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S ausgewählt sind und der Rest unsubstituiert oder substituiert ist,

R^3 Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro oder einen Rest der Formel $-Z^1-R^7$,

R^4 Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 10 C-Atomen, vorzugsweise mit 1 bis 6 C-Atomen, oder einen Heterocyclrest, Heterocyclxyrest oder Heterocyclaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder einen Acylrest,

- R^5 Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro oder einen Rest der Formel $-Z^2-R^8$,
- R^6 , wenn $n = 1$, oder die Reste R^6 jeweils unabhängig voneinander, wenn n größer als 1 ist, Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro oder eine Gruppe der Formel $-Z^3-R^9$,
- R^7 , R^8 , R^9 jeweils unabhängig voneinander
- Wasserstoff oder
 - einen acyclischen Kohlenwasserstoffrest, beispielsweise jeweils mit 1 bis 20 C-Atomen, vorzugsweise mit 1 bis 10 C-Atomen, wobei in der Kette Kohlenstoffatome durch Heteroatome aus der Gruppe N, O und S substituiert sein können, oder
 - einen cyclischen Kohlenwasserstoffrest, vorzugsweise mit 3 bis 8 C-Atomen, insbesondere 3 bis 6 C-Atomen, oder
 - einen heterocyclischen Rest, vorzugsweise mit 3 bis 9 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder substituiert ist,
- Z^1 , Z^2 , Z^3 jeweils unabhängig voneinander
- eine direkte Bindung oder
 - eine divalente Gruppe der Formel $-O-$, $-S(O)_p-$, $-S(O)_p-O-$, $-O-S(O)_p-$, $-CO-$, $-CS-$, $-S-CO-$, $-CO-S-$, $-O-CS-$, $-CS-O-$, $-S-CS-$, $-CS-S-$, $-O-CO-$, $-CO-O-$, $-NR'-$, $-O-NR'-$, $-NR'-O-$, $-NR'-CO-$ oder $-CO-NR'-$, wobei $p = 0$, 1 oder 2 ist und R' Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, Phenyl, Benzyl, Cycloalkyl mit 3 bis 6 C-Atomen oder Alkanoyl mit 1 bis 6 C-Atomen ist,
- Y^1 , Y^2 , Y^3 und weitere Gruppen Y^2 , wenn $m = 2$, 3 oder 4 ist, jeweils unabhängig voneinander
- eine divalente Gruppe der Formel CR^aR^b , wobei R^a und R^b gleich oder verschieden sind und jeweils einen Rest aus der Gruppe der für R^7 bis R^9 möglichen Reste bedeuten, oder
 - eine divalente Gruppe der Formel $-O-$, $-CO-$, CS , $-CH(OR^*)-$, $-C(=NR^*)-$, $-S(O)_q-$, $-NR^*$ oder $-N(O)-$, wobei $q = 0$, 1 oder 2 ist

und R⁺ Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder
- Y¹ oder Y³ eine direkte Bindung,
wobei zwei Sauerstoffatome der Gruppen Y² und Y³ nicht benachbart
sind.

- m 1, 2, 3 oder 4, insbesondere 1 oder 2,
- n 0, 1, 2, 3 oder 4, insbesondere 0, 1 oder 2,
bedeuten.

Die Verbindungen der Formel (I) können durch Anlagerung einer geeigneten anorganischen oder organischen Säure, wie beispielsweise HCl, HBr, H₂SO₄ oder HNO₃, aber auch Oxalsäure oder Sulfonsäuren an eine basische Gruppe, wie z.B. Amino oder Alkylamino, Salze bilden. Geeignete Substituenten, die in deprotonierter Form, wie z.B. Sulfonsäuren oder Carbonsäuren, vorliegen können, können innere Salze mit ihrerseits protonierbaren Gruppen, wie z. B. Aminogruppen, bilden. Salze können ebenfalls dadurch gebildet werden, daß bei geeigneten Substituenten, wie z.B. Sulfonsäuren oder Carbonsäuren, der Wasserstoff durch ein für die Landwirtschaft geeignetes Kation ersetzt wird. Diese Salze sind beispielsweise Metallsalze, insbesondere Alkalimetallsalze oder Erdalkalimetallsalze, insbesondere Natrium- und Kaliumsalze, oder auch Ammoniumsalze oder Salze mit organischen Aminen..

In Formel (I) und allen nachfolgenden Formeln können die Reste Alkyl, Alkoxy, Haloalkyl, Haloalkoxy, Alkylamino und Alkylthio sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Reste im Kohlenstoffgerüst jeweils geradkettig oder verzweigt sein. Wenn nicht speziell angegeben, sind bei diesen Resten die niederen Kohlenstoffgerüste, z.B. mit 1 bis 6 C-Atomen bzw. bei ungesättigten Gruppen mit 2 bis 6 C-Atomen, bevorzugt.

Alkylreste, auch in den zusammengesetzten Bedeutungen wie Alkoxy, Haloalkyl usw., bedeuten z.B. Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, t- oder 2-Butyl, Pentyle, Hexyle, wie n-Hexyl, i-Hexyl und 1,3-Dimethylbutyl, Heptyle,

wie n-Heptyl, 1-Methylhexyl und 1,4-Dimethylpentyl; Alkenyl- und Alkinylreste haben die Bedeutung der den Alkylresten entsprechenden möglichen ungesättigten Reste;

Alkenyl bedeutet z.B. Allyl, 1-Methylprop-2-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, But-2-en-1-yl, But-3-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl und 1-Methyl-but-2-en-1-yl; Alkinyl bedeutet z.B. Propargyl, But-2-in-1-yl, But-3-in-1-yl, 1-Methyl-but-3-in-1-yl.

Alkenyl in Form von (C_3-C_4) Alkenyl bedeutet vorzugsweise einen Alkenylrest mit 3 oder 4 C-Atomen, bei dem die Mehrfachbindung nicht zwischen C-1 und C-2 liegt, wobei C-1 das C-Atom mit der Position von "yl" bezeichnet. Entsprechendes gilt für (C_3-C_4) Alkinyl.

Cycloalkyl bedeutet ein carbocyclisches, gesättigtes Ringsystem mit vorzugsweise 3-8 C-Atomen, z.B. Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

Halogen bedeutet beispielsweise Fluor, Chlor, Brom oder Iod. Haloalkyl, -alkenyl und -alkinyl bedeuten durch Halogen, vorzugsweise durch Fluor, Chlor und/oder Brom, insbesondere durch Fluor oder Chlor, teilweise oder vollständig substituiertes Alkyl, Alkenyl bzw. Alkinyl, z.B. Monohaloalkyl (= Monohalogenalkyl), Perhaloalkyl, CF_3 , CHF_2 , CH_2F , CF_3CF_2 , CH_2FCHCl , CCl_3 , $CHCl_2$, CH_2CH_2Cl ; Haloalkoxy ist z.B. OCF_3 , $OCHF_2$, OCH_2F , CF_3CF_2O , OCH_2CF_3 und OCH_2CH_2Cl ; entsprechendes gilt für Haloalkenyl und andere durch Halogen substituierte Reste.

Ein Kohlenwasserstoffrest ist ein geradkettiger, verzweigter oder cyclischer und gesättigter oder ungesättigter aliphatischer oder aromatischer Kohlenwasserstoffrest, z.B. Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Aryl; Aryl bedeutet dabei ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System, beispielsweise Phenyl, Naphthyl, Tetrahydronaphthyl, Indenyl, Indanyl, Pentalenyl, Fluorenyl und ähnliches, vorzugsweise Phenyl; vorzugsweise bedeutet ein Kohlenwasserstoffrest Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl mit bis zu 12 C-Atomen oder Cycloalkyl mit 3, 4, 5, 6 oder 7 Ringatomen oder

Phenyl; entsprechendes gilt für einen Kohlenwasserstoffrest in einem Kohlenwasserstoffoxyrest.

Ein Cyclus bedeutet einen carbocyclischen oder heterocyclischen Rest, der gesättigt oder ungesättigt ist, wobei der Begriff "ungesättigt" auch teilungsgesättigte und aromatische Cyclen einschließt.

Ein heterocyclischer Rest oder Ring (Heterocyclyl) kann demnach gesättigt oder ungesättigt oder speziell heteroaromatisch sein; er enthält vorzugsweise ein oder mehrere Heteroeinheiten im Ring, d.h. Heteroatome oder Ringglieder, welche auch substituierte Heteroatome einschließen, vorzugsweise aus der Gruppe N, O, S, SO, SO₂; vorzugsweise ist er ein aliphatischer Heterocyclylrest mit 3 bis 7 Ringatomen oder ein heteroaromatischer Rest mit 5 oder 6 Ringatomen und enthält 1, 2 oder 3 Heteroeinheiten. Der heterocyclische Rest kann z.B. ein heteroaromatischer Rest oder Ring (Heteraryl) sein, wie z.B. ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System, in dem mindestens 1 Ring ein oder mehrere Heteroatome enthält, beispielsweise Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Thienyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Furyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl und Imidazolyl, oder ist ein partiell oder vollständig hydrierter Rest wie Oxiranyl, Pyrrolidyl, Piperidyl, Piperazinyl, Dioxolanyl, Morpholinyl, Tetrahydrofuryl.

Als Substituenten für einen substituierten heterocyclischen Rest kommen die weiter unten genannten Substituenten in Frage, zusätzlich auch Oxo. Die Oxogruppe kann auch an den Heteroringatomen, die in verschiedenen Oxidationsstufen existieren können, z.B. bei N und S, auftreten.

Substituierte Reste, wie substituierte Kohlenwasserstoffreste, z.B. substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Aryl, Phenyl und Benzyl, oder substituiertes Heterocyclyl oder Heteraryl, bedeuten beispielsweise einen vom unsubstituierten Grundkörper abgeleiteten substituierten Rest, wobei die Substituenten beispielsweise einen oder mehrere, vorzugsweise 1, 2 oder 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Alkoxy, Haloalkoxy, Alkylothio, Hydroxy, Amino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyl, Formyl,

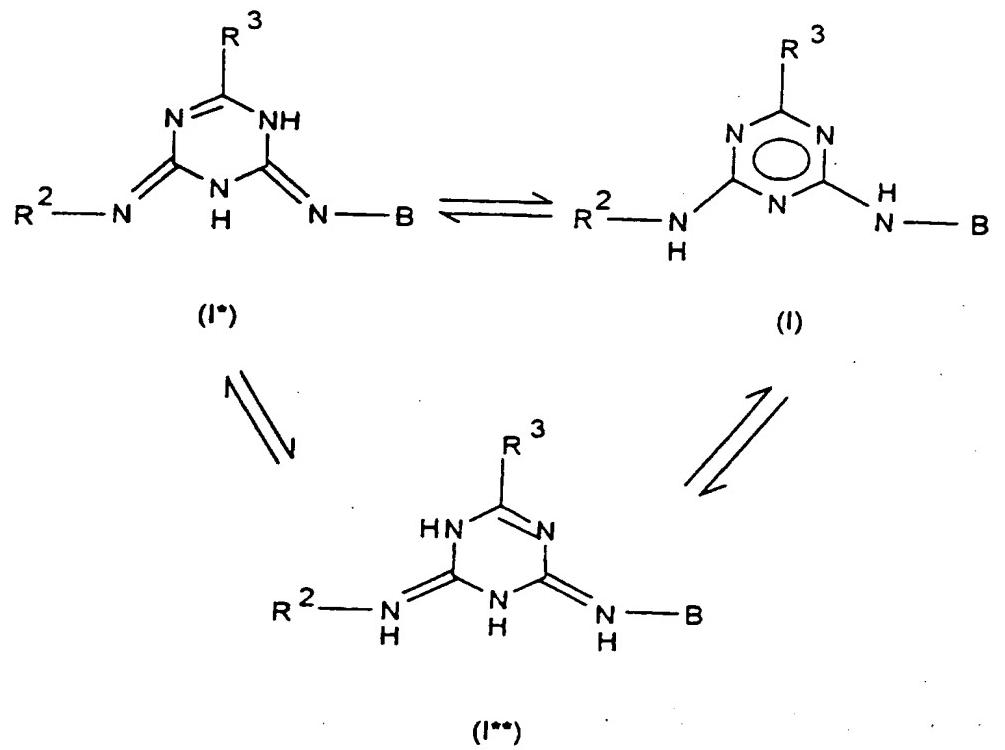
Carbamoyl, Mono- und Dialkylaminocarbonyl, substituiertes Amino, wie Acylamino, Mono- und Dialkylamino, und Alkylsulfinyl, Haloalkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch Alkyl und Haloalkyl bedeuten; im Begriff "substituierte Reste" wie substituiertes Alkyl etc. sind als Substituenten zusätzlich zu den genannten gesättigten kohlenwasserstoffhaltigen Resten entsprechende ungesättigte aliphatische und aromatische Reste, wie gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Phenyl, Phenoxy etc. eingeschlossen. Bei Resten mit C-Atomen sind solche mit 1 bis 4 C-Atomen, insbesondere 1 oder 2 C-Atomen, bevorzugt. Bevorzugt sind in der Regel Substituenten aus der Gruppe Halogen, z.B. Fluor und Chlor, (C_1-C_4)Alkyl, vorzugsweise Methyl oder Ethyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, vorzugsweise Trifluormethyl, (C_1-C_4)Alkoxy, vorzugsweise Methoxy oder Ethoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, Nitro und Cyano. Besonders bevorzugt sind dabei die Substituenten Methyl, Methoxy und Chlor.

Mono- oder disubstituiertes Amino bedeutet einen chemisch stabilen Rest aus der Gruppe der substituierten Aminoreste, welche beispielsweise durch einen bzw. zwei gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Alkyl, Alkoxy, Acyl und Aryl N-substituiert sind; vorzugsweise Monoalkylamino, Dialkylamino, Acylamino, Arylamino, N-Alkyl-N-arylamino sowie N-Heterocyclen; dabei sind Alkylreste mit 1 bis 4 C-Atomen bevorzugt; Aryl ist dabei vorzugsweise Phenyl oder substituiertes Phenyl; für Acyl gilt dabei die weiter unten genannte Definition, vorzugsweise (C_1-C_4)Alkanoyl. Entsprechendes gilt für substituiertes Hydroxylamino oder Hydrazino.

Gegebenenfalls substituiertes Phenyl ist vorzugsweise Phenyl, das unsubstituiert oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Halogenalkyl, (C_1-C_4)Halogenalkoxy und Nitro substituiert ist, z.B. o-, m- und p-Tolyl, Dimethylphenyle, 2-, 3- und 4-Chlorphenyl, 2-, 3- und 4-Trifluor- und -Trichlorphenyl, 2,4-, 3,5-, 2,5- und 2,3-Dichlorphenyl, o-, m- und p-Methoxyphenyl.

Ein Acylrest bedeutet den Rest einer organischen Säure, z.B. den Rest einer Carbonsäure und Reste davon abgeleiteter Säuren wie der Thiocarbonsäure, gegebenenfalls N-substituierten Iminocarbonsäuren oder den Rest von Kohlensäuremonoestern, gegebenenfalls N-substituierter Carbaminsäure, Sulfonsäuren, Sulfinsäuren, Phosphonsäuren, Phosphinsäuren. Acyl bedeutet beispielsweise Formyl, Alkylcarbonyl wie $[(C_1-C_4)Alkyl]-carbonyl$, Phenylcarbonyl, Alkyloxycarbonyl, Phenoxy carbonyl, Benzyloxycarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfinyl, N-Alkyl-1-iminoalkyl und andere Reste von organischen Säuren. Dabei können die Reste jeweils im Alkyl- oder Phenylteil noch weiter substituiert sein, beispielsweise im Alkylteil durch ein oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Alkoxy, Phenyl und Phenoxy; Beispiele für Substituenten im Phenylteil sind die bereits weiter oben allgemein für substituiertes Phenyl erwähnten Substituenten.

Gegenstand der Erfindung sind auch alle Stereoisomeren, die von Formel (I) umfaßt sind, und deren Gemische. Solche Verbindungen der Formel (I) enthalten ein oder mehrere asymmetrische C-Atome oder auch Doppelbindungen, die in der allgemeinen Formel (I) nicht gesondert angegeben sind. Die durch ihre spezifische Raumform definierten möglichen Stereoisomeren, wie Enantiomere, Diastereomere, Z- und E-Isomere sind alle von der Formel (I) umfaßt und können nach üblichen Methoden aus Gemischen der Stereoisomeren erhalten oder auch durch stereoselektive Reaktionen in Kombination mit dem Einsatz von stereochemisch reinen Ausgangsstoffen hergestellt werden. Von Formel (I) umfaßt sind auch mehr oder weniger stabile Tautomere, die durch Verschiebung einer oder mehrerer Doppelbindungen im Triazinring zu den Aminosubstituenten entstehen und iminartige Strukturen bilden, sofern der jeweilige Aminosubstituent in der Formel (I) eine N-H-Bindung enthalten hat (R^1 , R^2 und/oder $R^4 = H$). Beispiele dafür sind die tautomeren Strukturen der Formel (I*) und (I**) zur Formel (I) mit $R^1 = H$ und $R^4 = H$.



(B-Bicyclus wie in Formel (I))

Vor allem aus den Gründen der höheren herbiziden Wirkung, besseren Selektivität und/oder besseren Herstellbarkeit sind erfindungsgemäße Verbindungen der genannten Formel (I) oder deren Salze von besonderem Interesse, worin

R^7, R^8, R^9 jeweils unabhängig voneinander

- Wasserstoff oder
 - $(C_1-C_6)Alkyl$, $(C_2-C_6)Alkenyl$, $(C_2-C_6)Alkinyl$, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro und Reste der Formel $-Z^4-R^{10}$ substituiert ist, oder
 - $(C_3-C_8)Cycloalkyl$, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1-C_6)Alkyl$, $(C_1-C_6)Haloalkyl$, $(C_1-C_6)Haloalkoxy$, $(C_1-C_6)Alkoxy$, $(C_1-C_6)Alkylthio$,

- (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkanyl, (C₃-C₄)Alkenyloxy und (C₃-C₄)Alkinyloxy substituiert ist, oder
- Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro und Reste der Formel -Z⁵-R¹¹ substituiert ist, oder
 - einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 9 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro und Reste der Formel -Z⁶R¹² substituiert ist,
- Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶ jeweils unabhängig voneinander
- eine direkte Bindung oder
 - eine divalente Gruppe der Formel -O-, -S(O)_p-, -S(O)_p-O-, -O-S(O)_p-, -CO-, -CS-, -S-CO-, -CO-S-, -O-CO-, -CO-O-, -NR'-, -O-NR'-, -NR'-O-, -NR'-CO- oder -CO-NR'-, wobei p = 0, 1 oder 2 ist und R' Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, Phenyl, Benzyl, Cycloalkyl mit 3 bis 6 C-Atomen oder Alkanoyl mit 1 bis 6 C-Atomen ist,
 - vorzugsweise eine divalente Gruppe der Formel -O-, -S-, SO-, SO₂-, -CO-, -O-CO-, -CO-O-, -NR'-, NR'-CO- oder -CO-NR'-, wobei R' Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen oder Alkanoyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist,
 - insbesondere -O-, -CO-, -O-CO-, -CO-O-, -NR'-, NR'-CO- oder -CO-NR'-, wobei R' Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, und
- R¹⁰, R¹¹, R¹² jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₆)Alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkanyl, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkoxy und (C₁-C₄)Alkylthio substituiert ist, oder (C₃-C₈)Cycloalkyl, Phenyl, Heterocyclyl mit 3 bis 9 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der

letztgenannten 3 cyclischen Reste unsubstituiert oder substituiert ist, vorzugsweise unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro, $(C_1-C_6)Alkyl$, $(C_1-C_6)Haloalkyl$, $(C_1-C_6)Haloalkoxy$, $(C_1-C_6)Alkoxy$, $(C_1-C_6)Alkylothio$, $(C_2-C_6)Alkenyl$, $(C_2-C_6)Alkinyl$, $(C_3-C_4)Alkenyloxy$, $(C_3-C_4)Alkinyloxy$, $(C_1-C_6)Alkanoyl$, $(C_1-C_6)Alkoxycarbonyl$, Mono- und Di- $[(C_1-C_6)]amino$ substituiert ist, oder

jeweils zwei Reste $-Z^4-R^{10}$ oder $-Z^5-R^{11}$ oder $-Z^6-R^{12}$

gemeinsam mit dem Anknüpfungselement oder den jeweiligen Anknüpfungselementen einen Cyclus mit 3 bis 8 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1-C_4)Alkyl$ und Oxo substituiert ist, bedeuten.

Von besonderem Interesse sind weiterhin erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze, worin

R^1 und R^2 jeweils unabhängig voneinander

Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen im Alkylrest oder

einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen oder einen Heterocyclrest, Heterocycloxyrest oder Heterocyclaminorest mit jeweils 3 bis 9 Ringatomen, vorzugsweise 3 bis 6 Ringatomen, und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Haloalkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylothio$, $(C_2-C_4)Alkenyl$, $(C_2-C_4)Alkinyl$, $(C_2-C_4)Alkenyloxy$, $(C_2-C_4)Alkinyloxy$, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, $[(C_1-C_4)Alkoxy]-carbonyl$, $[(C_1-C_4)Alkyl]-carbonyl$, Formyl, Carbamoyl, Mono- und

Di-[(C₁-C₄)alkyl]-aminocarbonyl, Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, (C₁-C₄)Alkylsulfinyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl substituiert ist oder durch einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Gruppe Phenyl, Phenoxy, Cycloalkyl, Heterocyclyl und Heterocyclyloxy substituiert ist, oder einen Acylrest oder

R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR¹R² einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist.

R¹ und R² bedeuten vorzugsweise

- Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 2 C-Atomen im Alkylrest oder
- (C₁-C₆)Alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Mono- und Di-[(C₁-C₄)Alkyl]-amino, (C₃-C₉)Cycloalkyl, Heterocyclyl mit 3 bis 9 Ringatomen, Phenyl, Phenoxy, wobei jeder der letztgenannten 4 Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder
- (C₃-C₈)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Haloalkoxy, (C₁-C₄)Alkoxy und (C₁-C₄)Alkylthio substituiert ist, oder
- Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste substituiert ist, oder
- einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 9 Ringatomen und 1 bis 3

Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste substituiert ist, oder
einen Acylrest.

Von besonderem Interesse sind weiterhin erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze, worin

R^4 Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen im Alkylrest,
einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder
Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen oder einen
Heterocyclrest, Heterocyclxyrest oder Heterocyclaminorest mit
jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe
N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder
durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkoxy,
 (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl, (C_2-C_4) Alkinyl,
 (C_2-C_4) Alkenyloxy, (C_2-C_4) Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino,
Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido,
 $[(C_1-C_4)$ Alkoxy]-carbonyl, $[(C_1-C_4)$ Alkyl]-carbonyl, Formyl, Carbamoyl,
Mono- und Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylsulfinyl,
 (C_1-C_4) Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl, (C_1-C_4) Haloalkylsulfonyl
und, im Falle cyclischer Reste, auch (C_1-C_4) Alkyl und (C_1-C_4) Haloalkyl
substituiert ist oder durch einen unsubstituierten oder substituierten Rest
aus der Gruppe Phenyl, Phenoxy, Cycloalkyl, Heterocycl und
Heterocyclxy substituiert ist, oder
einen Acylrest

bedeutet.

Beispielsweise sind erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze solche, worin

R^1, R^2 unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkyl, Cyano- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino, Halo- (C_1-C_4) alkyl, Hydroxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, Halo- (C_1-C_4) alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Haloalkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, (C_2-C_6) Haloalkinyl, (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkyl-amino- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkyl, Heterocyclyl- (C_1-C_4) alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C_1-C_4) Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, Phenylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Mono- oder Di- $[(C_1-C_4)$ Alkyl]-amino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Heterocyclyl, Heterocycllamino, Heterocycloxy, Heterocyclthio, oder einen der letztgenannten 17 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl und (C_1-C_4) Alkoxy substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder R^1 und R^2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^1R^2 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist, R^3 Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, Formyl,

Aminocarbonyl, $(C_1-C_8)Alkyl$, Cyano- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylamino$, Di- $[(C_1-C_4)alkyl]-amino$, Halo- $(C_1-C_4)alkyl$, Hydroxy- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, Halo- $(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkylthio$, Halo- $(C_1-C_4)alkylthio$, $(C_2-C_6)Alkenyl$, Halo- $(C_2-C_6)Alkenyl$, $(C_2-C_6)Alkinyl$, Halo- $(C_2-C_6)Alkinyl$, $(C_1-C_4)Alkylamino-(C_1-C_4)alkyl$, Di- $[(C_1-C_4)alkyl]-amino-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_3-C_9)Cycloalkyl-amino-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_3-C_9)Cycloalkyl$, $(C_3-C_9)Cycloalkyl-(C_1-C_4)alkyl$, Heterocyclyl- $(C_1-C_4)alkyl$ mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 4 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe $(C_1-C_4)Alkyl$, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, Phenylcarbonyl- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkylamino-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkyl-carbonyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl$, Mono- oder Di- $[(C_1-C_4)Alkyl]-amino-carbonyl$, Phenoxy- $(C_1-C_4)alkyl$, Phenyl- $(C_1-C_4)alkyl$, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocycl oxy, Heterocycl thio oder einen der letztgenannten 17 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylthio$, $(C_1-C_4)Haloalkyl$, $(C_1-C_4)Haloalkoxy$, Formyl, $(C_1-C_4)Alkyl-carbonyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält,

R^4 Wasserstoff, Amino, Formyl, Aminocarbonyl, $(C_1-C_4)Alkyl$, Cyano- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkylamino$, Di- $[(C_1-C_4)alkyl]-amino$, Halo- $(C_1-C_4)alkyl$, Hydroxy- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, Halo- $(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_2-C_6)Alkenyl$, Halo- $(C_2-C_6)Alkenyl$, $(C_2-C_6)Alkinyl$, Halo- $(C_2-C_6)Alkinyl$, $(C_1-C_4)Alkylamino-(C_1-C_4)alkyl$, Di- $[(C_1-C_4)alkyl]-amino-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_3-C_9)Cycloalkylamino-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_3-C_9)Cycloalkyl$, Heterocyclyl- $(C_1-C_4)alkyl$ mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen

oder mehrere Reste, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)Alkyl]-amino-carbonyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 17 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Formyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält,

- R⁵ Wasserstoff, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Halo(C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)alkylthio, (C₂-C₆)Alkenyl, Halo-(C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)Alkynyl, Halo-(C₂-C₆)alkynyl, (C₁-C₄)Alkylamino-(C₁-C₄)alkyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkylamino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)Alkyl]-amino-carbonyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 17 Reste, der im acyclischen Teil oder,

vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Formyl, (C₁-C₄)Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl und (C₁-C₄)Alkoxy substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält,

R⁶ wenn n = 1 ist, und die Reste R⁶, jeweils unabhängig voneinander, wenn n größer als 1 ist, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Halo(C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)alkylthio, (C₂-C₆)Alkenyl, Halo-(C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, Halo-(C₂-C₆)alkinyl, (C₁-C₄)Alkylamino-(C₁-C₄)alkyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkylamino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-carbonyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocycloloxy, Heterocyclylthio oder einen der letztgenannten 17 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Formyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3

Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält oder wobei zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen bedeuten, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,

Y¹, Y², Y³ und weitere Gruppen Y², wenn m 2, 3 oder 4 ist, jeweils unabhängig voneinander

- eine divalente Gruppe der Formel CR^aR^b, wobei R^a und R^b gleich oder verschieden sind und jeweils einen wie weiter unten definierten Rest bedeuten, oder
- eine divalente Gruppe der Formel -O-, -S-, -SO-, SO₂, -CO-, -CS-, -CH(OR^{*})-, -C(=NR^{*})-, -NR^{*}- oder -N(O)-, wobei R^{*} Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder
- Y¹ oder Y³ eine direkte Bindung,

wobei zwei Sauerstoffatome der Gruppen Y¹ bis Y³ nicht benachbart sind, R^a, R^b Wasserstoff, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Halo(C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)alkylthio, (C₂-C₆)Alkenyl, Halo-(C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, Halo-(C₂-C₆)alkinyl, (C₁-C₄)Alkylamino-(C₁-C₄)alkyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkylamino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cyclo-alkyl, Heterocycl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)Alkyl]-amino-carbonyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl,

Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclithio, oder einen der letztgenannten 17 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Formyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält,

m 0, 1, 2, 3 oder 4, insbesondere 1 oder 2, und

n 0, 1, 2, 3 oder 4, insbesondere 0, 1 oder 2, bedeuten.

Bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) und deren Salze sind solche, worin

R¹, R² unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl oder Aminocarbonyl oder R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR¹R² einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,

R³ Wasserstoff, Carboxy, Cyano, (C₁-C₈)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Halo-(C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, Halo-(C₂-C₆)Alkenyl, (C₁-C₄)Alkylamino-(C₁-C₄)alkyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkylamino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 4 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl und Halogen substituiert

sind, oder Phenyl, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, oder einen der letztgenannten 10 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy, substituiert ist,
wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 7 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält.

R⁴ Wasserstoff, Amino, Formyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, Halo-(C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, Phenyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, oder einen der letztgenannten 5 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy substituiert ist,

R⁵ Wasserstoff, (C₁-C₄)Alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl oder (C₂-C₆)Alkinyl,

R⁶ wenn n = 1 ist, und die Reste R⁶, jeweils unabhängig voneinander, wenn n größer als 1 ist, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylamino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, (C₁-C₄)Alkylamino-(C₁-C₄)alkyl oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl oder einen der letztgenannten 3 Reste, der durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Alkoxy substituiert ist,

Y¹ eine direkte Bindung oder CH₂,

(Y²)_m einen divalenten Rest der Formel -CH₂-, -CH(CH₃)-, -C(CH₃)₂-, -CH₂CH₂-, -CH(CH₃)-CH₂-, -CH(CH₃)-CH(CH₃)-, -CH₂CH(CH₃)-, -CH(C₆H₅)-CH₂-, -CH₂CH(C₆H₅)- oder -CH(CH₃)-CH(C₆H₅)-,

Y^3 eine direkte Bindung oder einen divalenten Rest der Formel CH_2 ,
 $-CH(CH_3)-$, $-C(CH_3)_2-$, $CH(OH)$, $-O-$, $-S-$, CO , SO_2 , NH , $N(CH_3)$, $N(C_2H_5)$,
 $N(n-C_3H_7)$, $N(i-C_3H_7)$, $N(n-C_4H_9)$, $N(i-C_4H_9)$, $N(s-C_4H_9)$, $N(t-C_4H_9)$,
 $N(C_6H_5)$ oder $N(CH_2C_6H_5)$, vorzugsweise eine direkte Bindung, CH_2 , $-O-$
oder $-S-$, und

n 0, 1, 2 oder 3

bedeuten.

Besonders bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) und deren Salze sind solche, worin

R^1 , R^2 unabhängig voneinander Wasserstoff oder $(C_1-C_4)Alkyl$ oder
 R^1 und R^2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^1R^2 einen
gesättigten heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2
Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere
Heteroringatom aus der Gruppe N und O ausgewählt ist,

R^3 $(C_1-C_8)Alkyl$, Cyano- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Haloalkyl$, Hydroxy- $(C_1-C_4)alkyl$,
 $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, Halo- $(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_2-C_6)Alkenyl$,
Halo- $(C_2-C_6)Alkenyl$, $(C_1-C_4)Alkylamino-(C_1-C_4)alkyl$, Di-[$(C_1-C_4)alkyl$]-amino- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_3-C_9)Cycloalkylamino-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_3-C_9)Cycloalkyl$,
 $(C_3-C_9)Cycloalkyl-(C_1-C_4)alkyl$, gesättigtes Heterocyclyl- $(C_1-C_4)alkyl$, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 4
Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste, vorzugsweise
bis zu drei Reste, aus der Gruppe $(C_1-C_4)Alkyl$ und Halogen substituiert
sind, oder Phenyl, Phenylcarbonyl- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl$ -
 $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkylamino-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl$, Phenoxy- $(C_1-C_4)alkyl$,
Phenyl- $(C_1-C_4)alkyl$, Heterocyclyl, oder einen der letztgenannten
7 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil
durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, $(C_1-C_4)Alkyl$,
 $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Haloalkyl$, $(C_1-C_4)Alkyl-carbonyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl$ und $(C_1-C_4)Alkoxy$ substituiert ist,
wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 7 Ringatome und 1 bis 3

Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält,

R^4 Wasserstoff, Amino, Formyl, Aminocarbonyl, $(C_1-C_4)Alkyl$, Cyano- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkylamino$, $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_2-C_6)Alkenyl$, Halo- $(C_2-C_6)alkenyl$, $(C_2-C_6)Alkinyl$, Phenyl, $(C_1-C_4)Alkyl-carbonyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl$, Phenoxy- $(C_1-C_4)alkyl$, Phenyl- $(C_1-C_4)alkyl$, oder einen der letztgenannten 5 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$ substituiert ist,

R^5 Wasserstoff oder $(C_1-C_4)Alkyl$,

R^6 wenn $n = 1$ ist, und die Reste R^6 , jeweils unabhängig voneinander, wenn n größer als 1 ist, Halogen, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$ oder Halo- $(C_1-C_4)alkyl$,

Y^1 eine direkte Bindung oder CH_2 ,

$(Y^2)_m$ einen divalenten Rest der Formel CH_2 oder CH_2CH_2 , vorzugsweise CH_2CH_2 ,

Y^3 eine direkte Bindung, CH_2 , -O- oder -S-, vorzugsweise CH_2 , und

$n = 0, 1, 2$ oder 3

bedeuten.

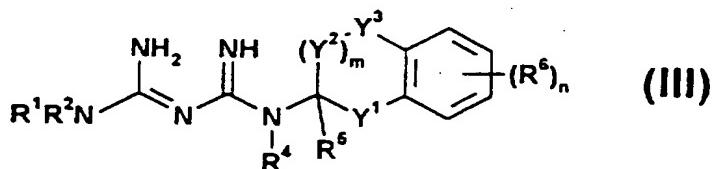
Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist auch ein Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze, dadurch gekennzeichnet, daß man

a) eine Verbindung der Formel (II),



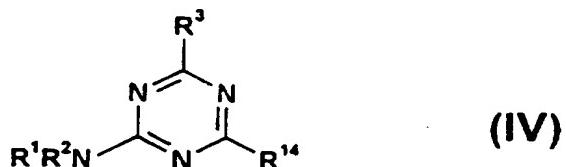
worin R^{13} eine funktionelle Gruppe aus der Gruppe Carboxy und Derivate der Carboxygruppe, beispielsweise Carbonsäureester,

Carbonsäureorthoester, Carbonsäurechlorid, Carbonsäureamid, Carbonsäureanhydrid Trichlormethylketo und Trichlormethyl bedeutet, mit einem Biguanidid der Formel (III) oder einem Säureadditionssalz hiervon

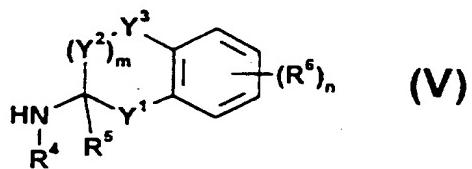


umsetzt oder

- b) eine Verbindung der Formel (IV),

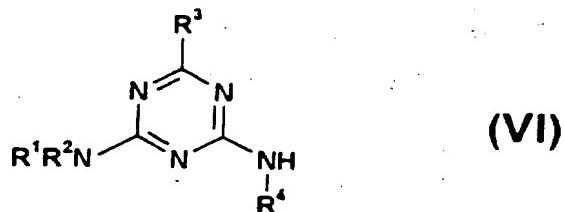


worin R¹⁴ einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe bedeutet, z.B. eine Abgangsgruppe wie Chlor, Trichlormethyl, (C₁-C₄)Alkylsulfonyl und unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)alkylsulfonyl oder (C₁-C₄)Alkyl-phenylsulfonyl, mit einem geeigneten Amin der Formel (V) oder einem Säureadditionssalz hiervon

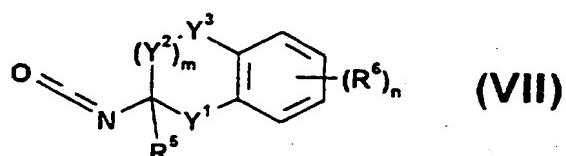


umsetzt oder

- c) ein Diamino-1,3,5-triazin der Formel (VI)



mit einem Isocyanat der Formel (VII)



umsetzt,

wobei in den Formeln (II), (III), (IV), (V), (VI) und (VII) die Reste R¹, R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ sowie Y¹, Y², Y³, m und n wie in Formel (I) definiert sind.

Die Umsetzung der Verbindungen der Formeln (II) und (III) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie z.B. Tetrahydrofuran (THF), Dioxan, Acetonitril, Dimethylformamid (DMF), Methanol und Ethanol, bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 20 °C bis 60 °C; falls Säureadditionssalze der Formel (III) verwendet werden, setzt man diese in der Regel mit Hilfe einer Base *in situ* frei. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei beispielsweise im Bereich von 0,1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (III) eingesetzt. Die Verbindung der Formel (II) kann im Verhältnis zur Verbindung der Formel (III) beispielsweise äquimolar oder mit bis zu 2 Moläquivalenten Überschuß eingesetzt werden. Die Verfahren sind in analoger Weise aus der Literatur bekannt (vergleiche:

Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A.R. Katritzky, C.W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984, Vol.3; Part 2B; ISBN 0-08-030703-5, S.290).

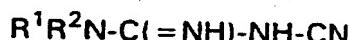
Die Umsetzung der Verbindungen der Formel (IV) und (V) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie z.B. THF, Dioxan, Acetonitril, DMF, Methanol und Ethanol, bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des jeweiligen Lösungsmittels oder Lösungsmittelgemisches, vorzugsweise bei 20 °C bis 60 °C, wobei die Verbindung (V), falls als Säureadditionssalz eingesetzt, gegebenenfalls in situ mit einer Base freigesetzt wird. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei in der Regel im Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (IV) eingesetzt, die Verbindung der Formel (IV) kann beispielsweise äquimolar zur Verbindung der Formel (V) oder mit bis zu 2 Moläquivalenten Überschuß eingesetzt werden. Die entsprechenden Verfahren sind im Prinzip aus der Literatur bekannt (vgl. Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A.R. Katritzky, C.W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984, Vol.3; Part 2B; ISBN 0-08-030703-5; S. 482).

Die Umsetzung der Diamino-1,3,5-triazine der Formel (VI) mit Isocyanaten der Formel (VII) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie z.B. Tetrahydrofuran (THF), Dioxan, Acetonitril, Dimethylformamid (DMF) bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittel, vorzugsweise bei 20 °C bis 60 °C. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei beispielsweise im Bereich von 0,5 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die

Verbindung der Formel (VI) eingesetzt. Die Verbindung der Formel (VII) kann im Verhältnis zur Verbindung der Formel (VI) beispielsweise äquimolar oder mit geringem Überschuß eingesetzt werden. Die entsprechenden Verfahren für acyclische und aromatische Derivate sind im Prinzip aus der Literatur bekannt (vergl. B. Singh; Heterocycles, 1993, 34, S. 929 - 935).

Die Edukte der Formeln (II), (III), (IV), (V), (VI) und (VII) sind entweder kommerziell erhältlich oder können nach oder analog literaturbekannten Verfahren hergestellt werden. Die Verbindungen können beispielsweise auch nach einem der nachfolgend beschriebenen Verfahren hergestellt werden.

Die Biguanidide der Formel (III) können beispielsweise durch Reaktion von Cyanoguanidinen der Formel



worin R^1 und R^2 wie in Formel (I) definiert sind, mit Aminen der genannten Formel (V), vorzugsweise in Form der Hydrohalogenide oder anderer Säureadditionssalze, erhalten werden.

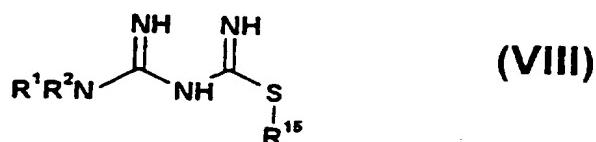
Hierzu können beispielsweise beide Komponenten in einem inerten Lösungsmittel, z.B. einem höhersiedenden, gegebenenfalls chlorierten Kohlenwasserstoff wie Dichlorbenzol, auf 100 bis 190°C erhitzt werden, wobei die als Salze anfallenden Biguanidine durch Absaugen isoliert werden können. Entsprechend Verfahren sind bekannt; siehe beispielsweise L. L. Shapiro, V. A. Parrino, L. Freedmann in JACS 81 (1959) 3728 oder H. M. Eisa, A. S. Tantawy und M. M. Kerdawy in Pharmazie 46 (1991) 182 ff. Die Umsetzungen können gegebenenfalls durch Zusatz von Metallsalzen wie Kupfer(II)sulfat, Zink(II)chlorid oder Eisen(III)chlorid katalysiert werden (T. Suyama, T. Soga, K. Miauchi in NIPPON KAGAKU KAISHI (1989), (5), 884-887), wobei die Reaktion dann zumeist bei niedrigeren Temperaturen im Bereich von 50°C bis zum Rückfluß der betreffenden Lösungsmittel erfolgen kann. Gegebenenfalls kann

die Reaktion in einer Vielzahl von Lösungsmitteln wie Tetrahydrofuran (THF), Dioxan, Alkoholen oder Ethern durchgeführt werden.

Die für die Herstellung der Biguanidine der Formel (III) eingesetzten Amine der Formel (V) werden auch in dem alternativen Verfahren b) zur Herstellung von Verbindungen (I) eingesetzt (siehe unten).

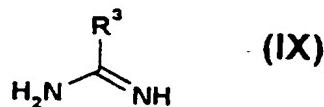
Die Verbindung der Formel (IV), oder eine direkte Vorstufe davon, lässt sich beispielweise wie folgt herstellen:

1. Durch Reaktion einer Verbindung der Formel (II) mit einem Amidino-thioharnstoff-Derivat der Formel (VIII),

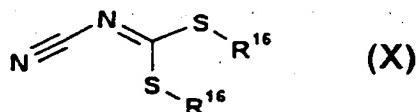


worin R^{15} ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-Alkyl oder Phenyl- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -alkyl bedeutet und R^1 und R^2 wie in Formel (I) definiert sind, werden Verbindungen der Formel (IV) erhalten, in denen $\text{R}^{14} = -\text{SR}^{15}$ bedeutet.

2. Durch Umsetzung eines cyclischen Amidins der Formel (IX) oder eines Säureadditionssalzes davon,

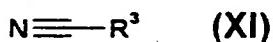


worin R^3 wie in Formel (I) definiert ist,
mit einem N-Cyanodithioiminocarbonat der Formel (X),

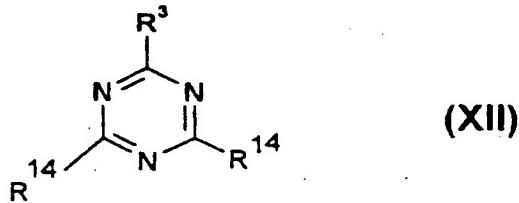


worin R^{16} ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-Alkyl oder Phenyl- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -alkyl bedeutet, werden Verbindungen der Formel (IV) erhalten, worin $\text{R}^{14} = -\text{S}-\text{R}^{16}$ bedeutet.

3. Durch Umsetzung eines Alkali-dicyanamids mit einem cyclischen Carbonsäurederivat der genannten Formel (II) werden Verbindungen der Formel (IV) erhalten, worin $\text{R}^{14} = \text{NH}_2$ bedeutet,
4. Durch Umsetzung von Trichloracetonitril mit einem Carbonsäurenitril der Formel (XI)



worin R^3 wie in Formel (I) definiert sind, werden zunächst Verbindungen der Formel (XII)



worin $\text{R}^{14} = \text{CCl}_3$ ist, erhalten, welche durch nachfolgende Umsetzung mit Verbindungen der Formel HNR^1R^2 (R^1 und R^2 wie in Formel (I)), zu Verbindungen der Formel (IV), worin $\text{R}^{14} = \text{CCl}_3$ bedeutet, führen.

Gegebenenfalls können analog den vorstehenden Verfahren unter 1.-4. auch andere Zwischenprodukte der Formel (XII) mit 2 austauschfähigen Gruppen R^{14} hergestellt werden (vgl. Formel (IV)) und die austauschfähigen Gruppen nacheinander mit geeigneten Aminen oder Ammoniak substituiert werden, um analog allgemein bekannten Verfahrensweisen zu Verbindungen der Formel (IV) bzw. Formel (I) zu gelangen. Ebenso können auch kommerziell erhältliche

Verbindungen oder nach anderen Verfahren herstellbare Verbindungen der Formel (XII) entsprechend modifiziert werden.

Gegebenfalls können analog den vorstehenden Verfahren unter 1.-4. erhaltene Zwischenprodukte der Formel (IV) oder (XII), worin R¹⁴ (C₁-C₄)-Alkylthio oder Phenyl-(C₁-C₄)-alkylthio bedeutet, durch eine Chlorierung oder Oxidation in reaktionsfähigere Derivate der Formeln (IV) oder (XII) umgewandelt werden.

Die Umsetzung der Carbonsäurederivate der Formel (II) mit den Amidinothioharnstoff-Derivaten der Formel (VIII) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem organischen Lösungsmittel, wie z.B. Aceton, THF, Dioxan, Acetonitril, DMF, Methanol, Ethanol, bei Temperaturen von -10 °C bis zum Siedepunkt des Lösungsmittel, vorzugsweise bei 0 °C bis 20 °C. Die Umsetzung kann aber auch in Wasser oder in wässrigen Lösungsmittelgemischen mit einem oder mehreren der obengenannten organischen Lösungsmitteln erfolgen. Falls (VIII) als Säureadditionssalz eingesetzt wird, kann es gegebenenfalls *in situ* mit einer Base freigesetzt werden. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei im Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (VIII) eingesetzt. Verbindungen der Formel (II) und (VIII) können beispielsweise äquimolar oder mit bis zu 2 Moläquivalenten Überschuß an Verbindung der Formel (II) eingesetzt werden (zu analogen Verfahren vergl.: H. Eilingsfeld, H. Scheuermann, Chem. Ber.; 1967, 100, 1874).

Die Umsetzung der Amidine der Formel (IX) mit den N-Cyanodithio-iminocarbonaten der Formel (X) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie z.B. Acetonitril, DMF, Dimethylacetamid (DMA), N-Methylpyrrolidon (NMP), Methanol und Ethanol, bei Temperaturen

von -10 °C bis zum Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C. Falls (IX) als Säureadditionssalz eingesetzt wird, kann es gegebenenfalls in situ mit einer Base freigesetzt werden. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei in Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (X) eingesetzt, Verbindungen der Formeln (IX) und (X) können in der Regel äquimolar oder mit 2 Moläquivalenten Überschuß an Verbindung der Formel (IX) eingesetzt werden (Analoge V erfahren siehe: T.A. Riley, W.J. Henney, N.K. Dalley, B.E. Wilson, R.K. Robins; J. Heterocyclic Chem.; 1986, 23 (6), 1706-1714).

Die Herstellung von Zwischenprodukten der Formel (XII) mit R¹⁴ = Chlor kann durch Reaktion von Alkali-dicyanamid mit einem Carbonsäurederivat der Formel (II), wobei dann R¹³ bevorzugt die funktionelle Gruppe Carbonsäurechlorid oder Carbonsäureamid bedeutet, erfolgen. Die Umsetzung der Reaktionskomponenten erfolgt beispielsweise säurekatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel wie z.B. Toluol, Chlorbenzol, chlorierten Kohlenwasserstoffen bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C, wobei die entstehenden Intermediate in situ mit einem geeigneten Chlorierungsreagenz wie beispielsweise Phosphoroxychlorid chloriert werden können. Geeignete Säuren sind z.B. Halogenwasserstoffsäuren, wie HCl, oder auch Lewis-Säuren, wie z.B. AlCl₃ oder BF₃ (vergl. US-A-5095113, DuPont).

Die Herstellung von Zwischenprodukten der Formel (XII) mit R¹⁴ = Trihalogenmethyl kann durch Reaktion der entsprechenden Trihalogenessigsäurenitrile mit einem Carbonsäurenitril der Formel (XI) erfolgen. Die Umsetzung der Reaktionskomponenten erfolgt beispielsweise säurekatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel wie z.B. Toluol,

Chlorbenzol, chlorierten Kohlenwasserstoffen bei Temperaturen zwischen -40 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei -10 °C bis 30 °C. Geeignete Säuren sind z.B. Halogenwasserstoffsäuren wie HCl oder auch Lewis-Säuren wie z.B. AlCl₃ oder BF₃ (vgl. EP-A-130939, Ciba Geigy).

Zwischenprodukte der Formeln (IV) oder (XII), worin R¹⁴ = (C₁-C₄)Alkyl-mercapto oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkylmercapto ist, können in einem inerten organischen Lösungsmittel wie z.B. Toluol, Chlorbenzol, chlorierten Kohlenwasserstoffen oder anderen bei Temperaturen zwischen -40°C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C, mit einem geeigneten Chlorierungsreagenz wie z.B. elementarem Chlor oder Phosphoroxychlorid zu reaktionsfähigeren Chlortriazinen der Formel (IV) oder (XII), worin R¹⁴ = Cl ist, überführt werden (vgl. J.K. Chakrabarti, D.E. Tupper; Tetrahedron 1975, 31(16), 1879-1882).

Zwischenprodukte der Formeln (IV) oder (XII), wobei R¹⁴ = (C₁-C₄)Alkylmercapto oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkylmercapto oder (C₁-C₄)Alkyl-phenylthio ist, können in einem geeigneten Lösungsmittel wie z.B. chlorierten Kohlenwasserstoffen, Essigsäure, Wasser, Alkoholen, Aceton oder Mischungen hiervon bei Temperaturen zwischen 0°C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise von 20°C bis 80°C, mit einem geeigneten Oxidationsreagenz wie z.B. m-Chlorperbenzoësäure, Wasserstoffperoxid, Kaliumperoxomonosulfat oxidiert werden (vergl.: T.A. Riley, W.J. Henney, N.K. Dalley, B.E. Wilson, R.K. Robins; J. Heterocyclic Chem.; 1986, 23 (6), 1706-1714).

Verbindungen analog der Formel (IV) erhält man auch durch selektive nucleophile Substitution von Verbindungen (XII) mit Aminen der Formel R¹R²NH oder Salzen hiervon, wobei das Salz in situ freigesetzt wird. Dabei wird eine der austauschfähigen Gruppen der Verbindungen der Formel (XII), wobei R¹⁴ beispielsweise für Halogen, Perhalomethyl, (C₁-C₄)Alkylsulfinyl, (C₁-

C₄) Alkylsulfonyl oder andere literaturbekannte Abgangsgruppen steht, in einem geeigneten Lösungsmittel wie z.B. THF, Dioxan, Alkohole, DMF oder Acetonitril oder Mischungen hiervon bei Temperaturen zwischen -10°C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 10°C bis 25°C, gegebenenfalls unter basischen Bedingungen mit dem Amin umgesetzt. Als Basen eignen sich dabei Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalcarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei in Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die V-Verbindung der Formel (XII) eingesetzt; das Nucleophil wird in der Regel äquimolar oder bis zu 2 Moläquivalenten im Überschuß eingesetzt und kann gegebenenfalls auch selbst als Base gebraucht werden (Vgl. analoge Verfahren aus: V.I. Kaelarev, Dibi Ammar, A.F. Lunin; Ximinya Geterosikl. Soedin., 1985, N11, 1557 - 1563).

Amine der Formel (V) können beispielsweise hergestellt werden durch Hydrierung der entsprechenden Oxime, die ihrerseits aus den entsprechenden Ketonen hergestellt werden können. So beschreiben A. B. Sen, S. B. Singh in J. Ind. Chem. Soc. 43 (1966) 521 ein analoges Verfahren, wobei die Umsetzung von Natrium zu Natriumethanolat als Wasserstoffquelle genutzt wird. Weiterhin schreiben Sarges et al. in J. Med. Chem. 16 (1973) 1003-1008 ein Verfahren zur Umwandlung eines Ketons in das Oxim und dessen palladiumkatalysierte Hydrierung zu einem entsprechenden Aminhydrochlorid. Auch sind Hydrierungen mit Raney-Nickel bekannt (D. Barbry, D. Couturier, N. Abdellatif, D. Lesieur, C. Espagnol; J. Heterocycl. Chem. 28 (1991) 449) oder auch Hydrierungen mit Borwasserstoff-Verbindungen (A. K. Gosh, S. P. McKee, W. M. Sanders; Tetrahedron Lett. 32 (1991) 711-714). Außerdem sind andere Verfahren bei entsprechenden bicyclischen Derivaten beschrieben und können zur Synthese von Aminen der Formel (V) angewendet werden.

Zur Herstellung der Säureadditionssalze der Verbindungen der Formel (I) kommen folgende Säuren in Frage: Halogenwasserstoffsäuren wie Chlorwasserstoffsäure oder Bromwasserstoffsäure, weiterhin Phosphorsäure, Salpetersäure, Schwefelsäure, mono- oder bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren wie Essigsäure, Maleinsäure, Bernsteinsäure, Fumarsäure, Weinsäure, Citronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure oder Milchsäure, sowie Sulfonsäuren wie p-Toluolsulfonsäure oder 1,5-Naphtalindisulfonsäure. Die Säureadditionsverbindungen der Formel (I) können in einfacher Weise nach den üblichen Salzbildungsmethoden, z.B. durch Lösen einer Verbindung der Formel (I) in einem geeigneten organischen Lösungsmittel wie z.B. Methanol, Aceton, Methylenechlorid oder Benzin und Hinzufügen der Säure bei Temperaturen von 0° bis 100°C erhalten werden und in bekannter Weise, z.B. durch Abfiltrieren, isoliert und gegebenenfalls durch Waschen mit einem inerten organischen Lösemittel gereinigt werden.

Die Basenadditionssalze der Verbindungen der Formel (I) werden vorzugsweise in inerten polaren Lösungsmitteln wie z.B. Wasser, Methanol oder Aceton bei Temperaturen von 0 bis 100 °C hergestellt. Geeignete Basen zur Herstellung der erfindungsgemäßen Salze sind beispielsweise Alkalicarbonate, wie Kaliumcarbonat, Alkali- und Erdalkalihydroxide, z.B. NaOH oder KOH, Alkali- und Erdalkalihydride, z.B. NaH, Alkali- und Erdalkoholate, z.B. Natriummethanolat, Kalium-tert.Butylat, oder Ammoniak oder Ethanolamin.

Mit den in den vorstehenden Verfahrensvarianten bezeichneten "inerten Lösungsmitteln" sind jeweils Lösungsmittel gemeint, die unter den jeweiligen Reaktionsbedingungen inert sind, jedoch nicht unter beliebigen Reaktionsbedingungen inert sein müssen.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, im folgenden zusammen als (erfindungsgemäße) Verbindungen der Formel (I) bezeichnet, weisen eine ausgezeichnete herbizide Wirksamkeit gegen ein breites

Spektrum wirtschaftlich wichtiger mono- und dikotyler Schadpflanzen auf. Auch schwer bekämpfbare perennierende Unkräuter, die aus Rhizomen, Wurzelstöcken oder anderen Dauerorganen austreiben, werden durch die Wirkstoffe gut erfaßt. Dabei ist es gleichgültig, ob die Substanzen im Vorsaat-, Vorauflauf- oder Nachauflaufverfahren ausgebracht werden.

Im einzelnen seien beispielhaft einige Vertreter der mono- und dikotylen Unkrautflora genannt, die durch die erfindungsgemäßen Verbindungen kontrolliert werden können, ohne daß durch die Nennung eine Beschränkung auf bestimmte Arten erfolgen soll.

Auf der Seite der monokotylen Unkrautarten werden z.B. Avena, Lolium, Alopecurus, Phalaris, Echinochloa, Digitaria, Setaria sowie Cyperusarten aus der annuellen Gruppe und auf Seiten der perennierenden Spezies Agropyron, Cynodon, Imperata sowie Sorghum und auch ausdauernde Cyperusarten gut erfaßt.

Bei dikotylen Unkrautarten erstreckt sich das Wirkungsspektrum auf Arten wie z.B. Galium, Viola, Veronica, Lamium, Stellaria, Amaranthus, Sinapis, Ipomoea, Matricaria, Abutilon und Sida auf der annuellen Seite sowie Convolvulus, Cirsium, Rumex und Artemisia bei den perennierenden Unkräutern.

Unter den spezifischen Kulturbedingungen im Reis vorkommende Unkräuter wie z.B. Sagittaria, Alisma, Eleocharis, Scirpus und Cyperus werden von den erfindungsgemäßen Wirkstoffen ebenfalls hervorragend bekämpft.

Werden die erfindungsgemäßen Verbindungen vor dem Keimen auf die Erdoberfläche appliziert, so wird entweder das Auflaufen der Unkrautkeimlinge vollständig verhindert oder die Unkräuter wachsen bis zum Keimblattstadium heran, stellen jedoch dann ihr Wachstum ein und sterben schließlich nach Ablauf von drei bis vier Wochen vollkommen ab.

Bei Applikation der Wirkstoffe auf die grünen Pflanzenteile im Nachauflaufverfahren tritt ebenfalls sehr rasch nach der Behandlung ein drastischer Wachstumsstop ein und die Unkrautpflanzen bleiben in dem zum Applikationszeitpunkt vorhandenen Wachstumsstadium stehen oder sterben nach einer gewissen Zeit ganz ab, so daß auf diese Weise eine für die Kulturpflanzen schädliche Unkrautkonkurrenz sehr früh und nachhaltig beseitigt wird.

Obgleich die erfindungsgemäßen Verbindungen eine ausgezeichnete herbizide Aktivität gegenüber mono- und dikotylen Unkräutern aufweisen, werden Kulturpflanzen wirtschaftlich bedeutender Kulturen wie z.B. Weizen, Gerste, Roggen, Reis, Mais, Zuckerrübe, Baumwolle und Soja nur unwesentlich oder gar nicht geschädigt. Die vorliegenden Verbindungen eignen sich aus diesen Gründen sehr gut zur selektiven Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Nutzpflanzungen.

Darüberhinaus weisen die erfindungsgemäßen Substanzen hervorragende wachstumsregulatorische Eigenschaften bei Kulturpflanzen auf. Sie greifen regulierend in den pflanzeneigenen Stoffwechsel ein und können damit zur gezielten Beeinflussung von Pflanzeninhaltsstoffen und zur Erleichterung wie z.B. durch Auslösen von Desikkation und Wuchsstauchung eingesetzt werden. Des Weiteren eignen sie sich auch zur generellen Steuerung und Hemmung von unerwünschtem vegetativen Wachstum, ohne dabei die Pflanzen abzutöten. Eine Hemmung des vegetativen Wachstums spielt bei vielen mono- und dikotylen Kulturen eine große Rolle, da das Lagern hierdurch verringert oder völlig verhindert werden kann.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in Form von Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, versprühbaren Lösungen, Stäubemitteln oder Granulaten in den üblichen Zubereitungen angewendet werden. Gegenstand der

Erfindung sind deshalb auch herbizide und pflanzenwachstumsregulierende Mittel, die Verbindungen der Formel (I) enthalten.

Die Verbindungen der Formel (I) können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem welche biologischen und/oder chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben sind. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen beispielsweise in Frage: Spritzpulver (WP), wasserlösliche Pulver (SP), wasserlösliche Konzentrate, emulgierbare Konzentrate (EC), Emulsionen (EW), wie Öl-in-Wasser- und Wasser-in-Öl-Emulsionen, versprühbare Lösungen, Suspensionskonzentrate (SC), Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis, ölmischbare Lösungen, Kapselsuspensionen (CS), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate für die Streu- und Bodenapplikation, Granulate (GR) in Form von Mikro-, Sprüh-, Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispergierbare

Granulate (WG), wasserlösliche Granulate (SG), ULV-Formulierungen, Mikrokapseln und Wachse.

Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc.,

N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, wie z.B. Insektiziden, Akariziden, Herbiziden, Fungiziden, sowie mit Safenern, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren herstellen, z.B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix.

Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Tenside ionischer und/oder nichtionischer Art (Netzmittel, Dispergiermittel), z.B. polyoxyethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, polyoxethylierte Fettamine, Fettalkoholpolyglykolethersulfate, Alkansulfonate, Alkylbenzolsulfonate, ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium, dibutynaphthalin-sulfonsaures Natrium oder auch oleoylmethyltaurinsaures Natrium enthalten. Zur Herstellung der Spritzpulver werden die herbiziden Wirkstoffe beispielsweise in üblichen Apparaturen wie Hammermühlen, Gebläsemühlen und Luftstrahlmühlen feingemahlen und gleichzeitig oder anschließend mit den Formulierungshilfsmitteln vermischt.

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösungsmittel z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen oder Mischungen der organischen Lösungsmittel unter Zusatz von einem oder mehreren Tensiden ionischer und/oder nichtionischer Art (Emulgatoren) hergestellt. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calcium-Salze wie Ca-dodecylbenzolsulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykolether, Fettalkoholpolyglykolether,

Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanester wie z.B. Sorbitanfettsäureester oder Polyoxethylensorbitanester wie z.B. Polyoxyethylensorbitanfettsäureester.

Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen, wie Kaolin, Bentonit und Pyrophyllit, oder Diatomeenerde.

Suspensionskonzentrate können auf Wasser- oder Ölbasis sein. Sie können beispielsweise durch Naß-Vermahlung mittels handelsüblicher Perlmühlen und gegebenenfalls Zusatz von Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, hergestellt werden.

Emulsionen, z.B. Öl-in-Wasser-Emulsionen (EW), lassen sich beispielsweise mittels Rührern, Kolloidmühlen und/oder statischen Mischern unter Verwendung von wässrigen organischen Lösungsmitteln und gegebenenfalls Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, herstellen.

Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise - gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln - granuliert werden.

Wasserdispergierbare Granulate werden in der Regel nach den üblichen Verfahren wie Sprühtrocknung, Wirbelbett-Granulierung, Teller-Granulierung, Mischung mit Hochgeschwindigkeitsmischern und Extrusion ohne festes

Inertmaterial hergestellt.

Zur Herstellung von Teller-, Fließbett-, Extruder- und Sprühgranulate siehe z.B. Verfahren in "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, Seiten 147 ff; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, S. 8-57.

Für weitere Einzelheiten zur Formulierung von Pflanzenschutzmitteln siehe z.B. G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Seiten 81-96 und J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, Seiten 101-103.

Die agrochemischen Zubereitungen enthalten in der Regel 0,1 bis 99 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 95 Gew.-%, Wirkstoff der Formel (I).

In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z.B. etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 1 bis 90, vorzugsweise 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten 1 bis 30 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen enthalten etwa 0,05 bis 80, vorzugsweise 2 bis 50 Gew.-% Wirkstoff. Bei wasserdispergierbaren Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden. Bei den in Wasser dispergierbaren Granulaten liegt der Gehalt an Wirkstoff beispielsweise zwischen 1 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 10 und 80 Gew.-% .

Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Konservierungs-, Frostschutz- und Lösungsmittel, Füll-, Träger- und Farbstoffe,

Entschäumer, Verdunstungshemmer und den pH-Wert und die Viskosität beeinflussende Mittel.

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäß Wirkstoffe in Mischungsformulierungen oder im Tank-Mix sind beispielsweise bekannte Wirkstoffe einsetzbar, wie sie in z.B. aus Weed Research 26, 441-445 (1986), oder "The Pesticide Manual", 10th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 1994 und dort zitierter Literatur beschrieben sind. Als literaturbekannte Herbizide, die mit den Verbindungen der Formel (I) kombiniert werden können, sind z.B. folgende Wirkstoffe zu nennen
(Anmerkung: Die Verbindungen sind entweder mit dem "common name" nach der International Organization for Standardization (ISO) oder mit dem

chemischen Namen, ggf. zusammen mit einer üblichen Codenummer bezeichnet):

acetochlor; acifluorfen; aclonifen; AKH 7088, d.h. [[[1-[5-[2-Chloro-4-(trifluoromethyl)-phenoxy]-2-nitrophenyl]-2-methoxyethylidene]-amino]-oxy]-essigsäure und -essigsäuremethylester; alachlor; aloxydim; ametryn; amidosulfuron; amitrol; AMS, d.h. Ammoniumsulfamat; anilofos; asulam; atrazin; azimsulfurone (DPX-A8947); aziprotryn; barban; BAS 516 H, d.h. 5-Fluor-2-phenyl-4H-3,1-benzoxazin-4-on; benazolin; benfluralin; benfuresate; bensulfuron-methyl; bensulide; bentazone; benzofenap; benzofluor; benzoyl-prop-ethyl; benzthiazuron; bialaphos; bifenoxy; bromacil; bromobutide; bromofenoxy; bromoxynil; bromuron; buminafos; busoxinone; butachlor; butamifos; butenachlor; buthidazole; butralin; butylate; cafenstrole (CH-900); carbetamide; cafentrazone (ICI-A0051); CDAA, d.h. 2-Chlor-N,N-di-2-propenylacetamid; CDEC, d.h. Diethyldithiocarbaminsäure-2-chlorallylester; chlormethoxyfen; chloramben; chlorazifop-butyl, chlormesulon (ICI-A0051); chlorbromuron; chlorbufam; chlorfenac; chlorflurecol-methyl; chloridazon; chlorimuron ethyl; chlornitrofen; chlorotoluron; chloroxuron; chlorpropham; chlorsulfuron; chlorthal-dimethyl; chlorthiamid; cinmethylin; cinosulfuron;

clethodim; clodinafop und dessen Esterderivate (z.B. clodinafop-propargyl); clomazone; clomeprop; cloproxydim; clopyralid; cumyluron (JC 940); cyanazine; cycloate; cyclosulfamuron (AC 104); cycloxydim; cycluron; cyhalofop und dessen Esterderivate (z.B. Butylester, DEH-112); cyperquat; cyprazine; cyprazole; daimuron; 2,4-DB; dalapon; desmedipham; desmetryn; di-allate; dicamba; dichlobenil; dichlorprop; diclofop und dessen Ester wie diclofop-methyl; diethatyl; difenoxuron; difenoquat; diflufenican; dimefuron; dimethachlor; dimethametryn; dimethenamid (SAN-582H); dimethazone, clomazon; dimethipin; dimetrasulfuron, dinitramine; dinoseb; dinoterb; diphenamid; dipropetryn; diquat; dithiopyr; diuron; DNOC; eglinazine-ethyl; EL 77, d.h. 5-Cyano-1-(1,1-dimethylethyl)-N-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamid; endothal; EPTC; esprocarb; ethalfluralin; ethametsulfuron-methyl; ethidimuron; ethiozin; ethofumesate; F5231, d.h. N-[2-Chlor-4-fluor-5-[4-(3-fluorpropyl)-4,5-dihydro-5-oxo-1H-tetrazol-1-yl]-phenyl]-ethansulfonamid; ethoxyfen und dessen Ester (z.B. Ethylester, HN-252); etobenzanid (HW 52); fenoprop; fenoxan, fenoxaprop und fenoxaprop-P sowie deren Ester, z.B. fenoxaprop-P-ethyl und fenoxaprop-ethyl; fenoxydim; fenuron; flamprop-methyl; flazasulfuron; fluazifop und fluazifop-P und deren Ester, z.B. fluazifop-butyl und fluazifop-P-butyl; fluchloralin; flumetsulam; flumeturon; flumiclorac und dessen Ester (z.B. Pentylester, S-23031); flumioxazin (S-482); flumipropyn; flupoxam (KNW-739); fluorodifen; fluoroglycofen-ethyl; flupropacil (UBIC-4243); fluridone; flurochloridone; fluroxypyrr; flurtamone; formesafen; fosamine; furyloxyfen; glufosinate; glyphosate; halosafen; halosulfuron und dessen Ester (z.B. Methylester, NC-319); haloxyfop und dessen Ester; haloxyfop-P (= R-haloxyfop) und dessen Ester; hexazinone; imazamethabenz-methyl; imazapyr; imazaquin und Salze wie das Ammoniumsalz; imazethamethapyr; imazethapyr; imazosulfuron; ioxynil; isocarbamid; isopropalin; isoproturon; isouron; isoxaben; isoxapryifop; karbutilate; lactofen; lenacil; linuron; MCPA; MCPB; mecoprop; mefenacet; mefluidid; metamitron; metazachlor; methabenzthiazuron; metham; methazole; methoxyphenone; methyldymron; metabenzuron, methobenzuron; metobromuron; metolachlor; metosulam (XRD 511); metoxuron; metribuzin;

metsulfuron-methyl; MH; molinate; monalide; monocarbamide dihydrogensulfate; monolinuron; monuron; MT 128, d.h. 6-Chlor-N-(3-chlor-2-propenyl)-5-methyl-N-phenyl-3-pyridazinamin; MT 5950, d.h. N-[3-Chlor-4-(1-methylethyl)-phenyl]-2-methylpentanamid; naproanilide; napropamide; naptalam; NC 310, d.h. 4-(2,4-dichlorbenzoyl)-1-methyl-5-benzylloxypyrazol; neburon; nicosulfuron; nipyrapophen; nitralin; nitrofen; nitrofluorfen; norflurazon; orbencarb; oryzalin; oxadiargyl (RP-020630); oxadiazon; oxyfluorfen; paraquat; pebulate; pendimethalin; perfluidone; phenisopham; phenmedipham; picloram; piperophos; piributicarb; pirifenop-butyl; pretilachlor; primisulfuron-methyl; procyzine; prodiamine; profluralin; proglazine-ethyl; prometon; prometryn; propachlor; propanil; propaquizafop und dessen Ester; propazine; prophan; propisochlor; propyzamide; prosulfalin; prosulfocarb; prosulfuron (CGA-152005); prynachlor; pyrazolinate; pyrazon; pyrazosulfuron-ethyl; pyrazoxyfen; pyridate; pyrithiobac (KIH-2031); pyroxofop und dessen Ester (z.B. Propargylester); quinclorac; quinmerac; quinoxfop und dessen Ester Esterderivate, quizalofop und quizalofop-P und deren Esterderivate z.B. quizalofop-ethyl; quizalofop-P-tefuryl und -ethyl; reniduron; rimsulfuron (DPX-E 9636); S 275, d.h. 2-[4-Chlor-2-fluor-5-(2-propynyloxy)-phenyl]-4,5,6,7-tetrahydro-2H-indazol; secbumeton; sethoxydim; siduron; simazine; simetryn; SN 106279, d.h. 2-[(7-[2-Chlor-4-(trifluor-methyl)-phenoxy]-2-naphthalenyl)-oxy]-propansäure und -methylester; sulcotrione, sulfentrazon (FMC-97285, F-6285); sulfazuron; sulfometuron-methyl; sulfosate (ICI-A0224); TCA; tebutam (GCP-5544); tebuthiuron; terbacil; terbucarb; terbuchlor; terbumeton; terbutylazine; terbutrym; TFH 450, d.h. N,N-Diethyl-3-[(2-ethyl-6-methylphenyl)-sulfonyl]-1H-1,2,4-triazol-1-carboxamid; thenylchlor (NSK-850); thiazafluron; thiazopyr (Mon-13200); thidiazimin (SN-24085); thifensulfuron-methyl; thiobencarb; tiocarbazil; tralkoxydim; tri-allate; triasulfuron; triazofenamide; tribenuron-methyl; triclopyr; tridiphane; trietazine; trifluralin; triflusulfuron und Ester (z.B. Methylester, DPX-66037); trimeturon; tsitodef; vernolate; WL 110547, d.h. 5-Phenoxy-1-[3-(trifluormethyl)-phenyl]-1H-tetrazol; UBH-509; D-489; LS 82-556; KPP-300;

NC-324; NC-330; KH-218; DPX-N8189; SC-0774; DOWCO-535; DK-8910; V-53482; PP-600; MBH-001; KIH-9201; ET-751; KIH-6127 und KIH-2023.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Formulierungen gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und wasserdispergierbaren Granulaten mittels Wasser. Staubförmige Zubereitungen, Boden- bzw. Streugranulate sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit, der Art des verwendeten Herbizids, u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge der Verbindungen der Formel (I). Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z.B. zwischen 0,001 und 10,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0,005 und 5 kg/ha.

A. Chemische Beispiele

Beispiel A1

(= Beispiel 25 in Tabelle 1)

2-Amino-4-(2-fluorphenyl)-6-(5,7-dimethyl-1,2,3,4-tetrahydro-naphthalin-1-amino)-1,3,5-triazin

- a. 27,0 g (0,13 mol) 1-Amino-5,7-dimethyl-1,2,3,4-tetrahydro-naphthalinhydrochlorid und 11,5 g (0,13 mol) Cyanoguanidin werden homogenisiert und in 60 ml Chlorbenzol aufgenommen. Diese Mischung wird 150 Minuten auf 140 - 160 °C erhitzt; hierbei entsteht zunächst ein homogenes Gemisch, welches sich dann aber wieder entmischt. Nach Abkühlen und Zugabe von 100 ml Toluol können nach Absaugen 40,0 g (94 % d.Th mit einer Reinheit größer 90 %) 1-Biguanidino-5,7-dimethyl-1,2,3,4-tetrahydro-

naphthalin-hydrochlorid mit einem Schmelzpunkt von 215 - 216 °C erhalten werden.

b. Zu 5,9 g (0,02 mol) 1-Biganidino-5,7-dimethyl-1,2,3,4-tetrahydro-naphthalin-hydrochlorid in 50 ml Methanol und 6 g gemahlenem Molsieb 3 Å wird eine aus 0,96 g (0,04 mol) Natrium und 50 ml Methanol hergestellte Methanolatlösung gegeben. Nachfolgend fügt man 4,4 g (0,026 mol) 2-Fluorbenzoësäureethylester hinzu und röhrt 2 Stunden bei 25 °C, dann 4 Stunden bei 65 °C. Die Reaktionsmischung wird filtriert, das Filtrat eingeengt und der Rückstand mit Essigester aufgenommen. Diese Lösung wird mit Wasser gewaschen, die organische Phase abgetrennt und mit Natriumsulfat getrocknet. Das Trockenmittel wird abfiltriert und die Essigesterphase eingedampft. Man erhält nach säulenchromatographischer Trennung über Kieselgel mit Essigester/Heptan im Verhältnis 7:3 als Laufmittel 3,9 g (54 % d.Th.) 2-Amino-4-(2-fluor-phenyl)-6-(5,7-dimethyl-1,2,3,4-tetrahydro-naphthalin-1-amino)-1,3,5-triazin mit einem Schmelzpunkt von 85 - 88 °C.

Bispiel A2

(= Beispiel 38 in Tabelle 1)

2-Amino-4-(2,3-dimethyl-2,3-epoxy-propyl)-6-(5,7-dimethyl-1,2,3,4-tetrahydro-naphthalin-1-amino)-1,3,5-triazin

a. Zu einer auf 0 - 2 °C gekühlten Mischung aus 17,4 g (0,3 mol) Aceton und 36,8 g (0,3 mol) 2-Chlorpropionsäuremethylester tropft man eine Suspension aus 37,1 g (0,3 mol) Kalium-tert.-butylat in 300 ml THF. Nach beendeter Zugabe lässt man auf Raumtemperatur kommen und röhrt weitere 60 Minuten. Nach Hydrolyse und Extraktion mit Diethylether, Trocknen der organischen Phase mit Natriumsulfat und Einrotieren werden 34,2 g (75 % d.Th. bei ca. 95 % Reinheit) 2,3-Epoxy-2,3-dimethyl-buttersäuremethylester erhalten. Dieses Produkt kann ohne weitere Reinigung in der Folgestufe eingesetzt werden.

b. Zu 5,2 g (0,0175 mol) 1-Biguanidino-5,7-dimethyl-1,2,3,4-tetrahydro-naphthalin-hydrochlorid in 50 ml Methanol und 6 g gemahlenem Molsieb 3Å wird eine aus 0,84 g (0,035 mol) Natrium und 50 ml Methanol hergestellte Methanolatlösung gegeben. Nachfolgend fügt man 3,8 g (0,026 mol) 2,3-Epoxy-2,3-dimethyl-buttersäuremethylester hinzu und röhrt 2 Stunden bei 25°C, dann 4 Stunden bei 65°C. Die Reaktionsmischung wird filtriert, das Filtrat eingeengt und der Rückstand mit Essigester aufgenommen. Diese Lösung wird mit Wasser gewaschen, die organische Phase abgetrennt und mit Natriumsulfat getrocknet. Das Trockenmittel wird abfiltriert und die Essigesterphase eingedampft. Man erhält nach säulenchromatographischer Trennung über Kieselgel mit Essigester als Laufmittel 1,4 g (24 % d.Th.) 2-Amino-4-(2,3-dimethyl-2,3-epoxy-propyl)-6-(5,7-dimethyl-1,2,3,4-tetrahydro-naphthalin-1-amino)-1,3,5-triazin mit einem Schmelzpunkt von 118 - 119 °C.

Beispiel A3

(= Beispiel 73 in Tabelle 1)

2-Amino-4-(5,7-dimethyl-thiochroman-4-amino)-6-(1-methyl-1-hydroxy-ethyl)-1,3,5-triazin

a. Zu einer Suspension aus 31,1 g (0,154 mol) 5,7-Dimethyl-thiochroman-4-on und 18,5 g (0,261 mol) Hydroxyl-aminhydrochlorid in 200 ml Ethanol wird bei 50 - 60 °C eine Suspension von 37,8 g Natriumacetat in Wasser gegeben. Dieses Gemisch wird sodann 30 Minuten auf Rückfluß erwärmt. Nach Abkühlen erhält man durch Absaugen des ausgefallenen Feststoffs 22,2 g 5,7-Dimethyl-thiochroman-4-on-oxim (66 % d. Th. mit ca. 95 % Reinheit) mit einem Schmelzpunkt von 170 - 174 °C.

b. 21,0 g (0,101 mol) 5,7-Dimethyl-thiochroman-4-on-oxim werden in 300 ml Ethanol suspendiert und portionsweise innerhalb einiger Stunden mit 22,5 g (0,935 mol) Natrium versetzt. Diese Mischung wird noch einige Zeit gerührt, dann etwas eingeengt. Der Rückstand wird mit Wasser versetzt, diese wässrige Phase dann mit halbkonzentrierter Salzsäure sauer gestellt, durch Absaugen des

ausgefallenen Feststoff können 11,5 g 4-Amino-5,7-dimethyl-thiochroman-hydrochlorid (47 % d. Th. mit ca. 95 % Reinheit) mit einem Schmelzpunkt von 275 - 280 °C erhalten werden. Das Produkt kann ohne weitere Reinigung in der nächsten Stufe eingesetzt werden.

c. 9,0 g (0,039 mol) 4-Amino-5,7-dimethyl-thiochroman-hydrochlorid und 3,4 g (0,039 mol) Cyanoguanidin werden homogenisiert und in 25 ml Chlorbenzol aufgenommen. Diese Mischung wird 150 Minuten auf 140-160 °C erhitzt; hierbei entsteht zunächst ein homogenes Gemisch, welches sich dann aber wieder entmischt. Nach Abkühlen und Zugabe von 30 ml Toluol können nach Absaugen 10,9 g (84 % d.Th mit einer Reinheit größer 90 %) 4-Biguanidino-5,7-dimethyl-thiochroman-hydrochlorid mit einem Schmelzpunkt von 210 - 211 °C erhalten werden. Das Produkt kann ohne weitere Reinigung in der nächste Stufe eingesetzt werden.

d. Zu 1,62 g (0,054 mol) Natriumhydrid in 40 ml Acetonitril gibt man 3,2 g (0,0108 mol) 4-Biguanidino-5,7-dimethyl-thiochroman-hydrochlorid und 5 g gemahlenes Molsieb 3Å. Nachfolgend fügt man 3,8g (0,027 mol) 2-Hydroxy-isobuttersäureethylester hinzu und röhrt 2 Stunden bei 25 °C, dann 8 Stunden bei 65 °C. Die Reaktionsmischung wird hydrolysiert und filtriert, das Filtrat wird mit Essigester aufgenommen. Die organische Phase wird abgetrennt und mit Natriumsulfat getrocknet. Das Trockenmittel wird abfiltriert und die Essigesterphase eingedampft. Man erhält nach säulenchromatographischer Trennung über Kieselgel mit Essigester als Laufmittel 0,4 g (10 % d.Th.) 2-Amino-4-(5,7-dimethyl-thiochroman-4-amino)-6-(1-methyl-1-hydroxy-ethyl)-1,3,5-triazin mit einem Schmelzpunkt von 231 - 232 °C.

Beispiel A4 (= Beispiel 636 in Tabelle 1)

2-Amino-4-ethyl-6-(1-indanyl-amino)-1,3,5-triazin

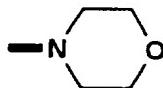
- a. Zu einer Suspension von 40,3 g (0,164 mol) einer 75 % toluolischen Lösung von 2,4-Dichlor-6-ethyl-1,3,5-triazin in 250 ml Toluol gibt man bei 10 bis 15°C 45 ml einer ca. 13 molaren Lösung von Ammoniak in Methanol und röhrt ca. 2 Stunden. Dieses Reaktionsgemisch wird hydrolysiert und mit Essigester extrahiert. Die organische Phase wird mit Natriumsulfat getrocknet, das Trockenmittel nachfolgend abfiltriert und die Essigesterphase eingedampft. Man erhält 26,5 g (91 % der Theorie bei 90 % Reinheit) 2-Amino-4-chlor-6-ethyl-1,3,5-triazin mit einem Schmelzpunkt von 125 bis 126°C. Dieses Zwischenprodukt kann ohne weitere Reinigung in die nachfolgende Reaktion eingesetzt werden.
- b. Zu 3,0 g (0,017 mol bei 90 % Reinheit) 2-Amino-4-chlor-6-ethyl-1,3,5-triazin und 2,5 g 1-Aminoundan in 30 ml Dimethylformamid gibt man 5,2 g (0,038 mol) Kaliumcarbonat und erwärmt diese Mischung 4 Stunden auf 100°C. Das Reaktionsgemisch wird hydrolysiert und anschließend mit Essigester extrahiert. Die organische Phase wird mit Natriumsulfat getrocknet, das Trockenmittel nachfolgend abfiltriert und die Essigesterphase eingedampft. Man erhält nach säulenchromatographischer Trennung über Kieselgel mit einer Essigester/Hexan-Mischung im Verhältnis 7:3 als Laufmittel 3,2 g (70 % d. Th. bei 95 % Reinheit) 2-Amino-4-ethyl-6-(1-indanyl-amino)-1,3,5-triazin mit einem Schmelzpunkt von 175 bis 178°C.

Die in der Tabelle 1 beschriebenen Verbindungen erhält man gemäß bzw. analog zu den vorstehenden Beispielen A1 bis A4. In der Tabelle verwendete Abkürzungen sind nachfolgend angegeben.

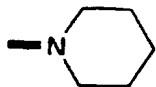
Abkürzungen in der Tabelle 1

| | | |
|-----------|---|---|
| Nr. | = | Beispiel oder Beispielnummer |
| Fp. | = | Festpunkt (Schmelzpunkt) in °C oder eine andere charakteristische Eigenschaft der jeweiligen Verbindung (z.B. fester Schaum = f. Schaum) |
| Me | = | Methyl |
| Et | = | Ethyl |
| Pr | = | Propyl = n-Propyl |
| i-Pr | = | Isopropyl |
| X-i-Pr | = | 1-X-i-Pr 1-substituiertes Isopropyl, z.B. F-i-Pr = 1-Fluor-isopropyl oder CF(CH ₃) ₂ , wobei hier die Radikalposition ("yl") die Position 1 ist, |
| c-Pr | = | Cyclopropyl |
| c-Hexyl | = | Cyclohexyl |
| 1-Me-c-Pr | = | 1-Methyl-cyclopropyl, wobei die Radikalposition ("yl") die Position 1 ist. |
| t-Bu | = | tertiär-Butyl |
| Ph | = | Phenyl |
| Bz | = | Benzyl |
| Ac | = | Acetyl |
| Ziffern | = | <ol style="list-style-type: none"> 1. Ziffer vor Substituenten bedeutet Position des Substituenten am Aromaten 2. Ziffer vor Heterocyclenresten bedeutet Radikalposition in bezug auf Heteroatom, z. B. 2-Pyridinyl = Pyridin-2-yl 3. Ziffer vor Substituenten R⁶ bedeutet Position des Substituenten am Aromaten entsprechend der Bezeichnung in der Formel (I') |

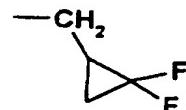
Morpholino =



Piperidino =



t1 = -2,2-difluorocycloprop-1-ylmethylen =

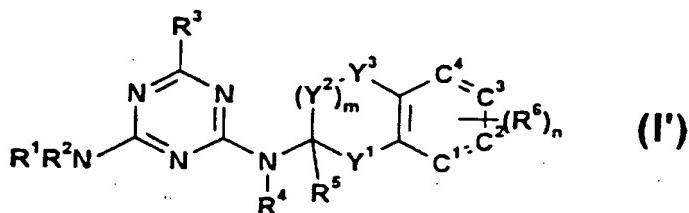


epoxid = 1,2-epoxy-eth-1-yl = oxiranyl

$(R^6)_n$ = alle Substituenten R^6 ; der Fall $(R^6)_n = H$ bedeutet keine Substituenten ($n = 0$)

$(Y^2)m$ = divalente Gruppe, die im unsymmetrisch substituierten Fall wie $-CH_2-CHPh-$ mit dem rechts angegebenen Kettenatom (hier: rechtes C-Atom) mit der Gruppe Y^3 verbunden ist.

Tabelle 1: Verbindungen der Formel (I')



| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|-----|--------------------------------|-----------------------------------|----------------|----------------|--------------------------------|----------------|-------------------------------------|--------------------|-----------|
| 1 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 2 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 141 - 142 |
| 3 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 128 - 130 |
| 4 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 5 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 6 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 7 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NMe- | |
| 8 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NMe- | |
| 9 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NMe- | |
| 10 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CO- | |
| 11 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CO- | |
| 12 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CO- | |
| 13 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CHOH- | |
| 14 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CHOH- | |
| 15 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CHOH- | |
| 16 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 17 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 18 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 19 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 3-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 20 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 3-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 21 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 3-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 22 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 2-Et | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 23 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Et, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 24 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Et, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 25 | NH ₂ | 2-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 85 - 88 |
| 26 | NH ₂ | 3-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 27 | NH ₂ | 4-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 28 | NH ₂ | 2-Me-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 29 | NH ₂ | 2-Et-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 30 | NH ₂ | 2-OH-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 31 | NH ₂ | 2-OMe-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 32 | NH ₂ | 2-CN-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 33 | NH ₂ | 2,4-F ₂ -Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 34 | NH ₂ | t-Bu | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 35 | NH ₂ | epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 36 | NH ₂ | 1-Me-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 37 | NH ₂ | 1-Me-2-Me-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|-----|--------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|--------------------------------|----------------|-------------------------------------|--------------------|-----------|
| 38 | NH ₂ | 1,2,2-Me ₃ -epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 118 - 119 |
| 39 | NH ₂ | 1-Me-2-Et-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 40 | NH ₂ | 1-Me-2-n-Bu-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 41 | NH ₂ | 2-Me-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 91 - 93 |
| 42 | NH ₂ | t1 | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 43 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 191 - 193 |
| 44 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 45 | NH ₂ | MeO-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 46 | NH ₂ | 1-HO-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 47 | NH ₂ | 1-MeO-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 48 | NH ₂ | 1-F-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 49 | NH ₂ | 1-Cl-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 50 | NH ₂ | 1-AcO-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 51 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 52 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | 3-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 53 | NH ₂ | MeO-i-Pr | H | H | 2-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 54 | NH ₂ | 2-Me-Bz | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 55 | NH ₂ | 1-Ph-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 56 | NH ₂ | 1-Ph-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 74 - 75 |
| 57 | NH ₂ | 1-Ph-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | |
| 58 | NH ₂ | 1-Ph-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 59 | NMe ₂ | 1-Ph-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 60 | NH ₂ | 1-Ph-c-Pr | H | H | 3-OMe | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 61 | NH | 1-Ph-c-Pr | H | H | 3-Me, 4-OMe | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 62 | NH ₂ | c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 63 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 64 | NH ₂ | 1-HO-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 65 | NH ₂ | 1-F-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 66 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | |
| 67 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | 125 - 129 |
| 68 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | |
| 69 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | |
| 70 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-F, 3-F | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | |
| 71 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | |
| 72 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | 228 - 230 |
| 73 | NH ₂ | 1-HO-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | 231 - 233 |
| 74 | NMe ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | |
| 75 | Morpholino | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | |
| 76 | NHAc | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | |
| 77 | NHNH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | |
| 78 | NHPiperidino | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | |
| 79 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | 193 - 195 |
| 80 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | Et | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -S- | |
| 81 | NH ₂ | t1 | H | H | 1Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CHMe- | -S- | |
| 82 | NH ₂ | 1-M-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ - | -S- | |

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|------|--------------------------------|----------------|----------------|---------------------|--------------------------------|--------------------|--------------------------------------|--------------------|----------|
| 83 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CMeH-CH ₂ - | -S- | |
| 84 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 4-Me | - | -CH ₂ -CHPh- | -S- | |
| 85 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CMe ₂ - | -S- | |
| 86 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-F, 3-F | - | -CH ₂ - | -S- | |
| 87 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -S- | |
| 88 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ - | -S- | |
| 89 | NH ₂ | 1-HO-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -S- | |
| 90 | NMe ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | -S- | |
| 91 | Morpholino | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -SO ₂ - | |
| 92 | NHAc | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -S- | |
| 93 | NHNH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -S- | |
| 94 | NHPiperidino | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -S- | |
| 95 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ - | -S- | |
| 96a | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-F | - | -CH ₂ - | -S- | |
| 97 | NH ₂ | t1 | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -S- | |
| 98 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 99 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | CMeHCH ₂ | -O- | |
| 100 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 4-Me | - | CH ₂ CHPh- | -O- | |
| 101 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | CH ₂ CMe ₂ - | -O- | |
| 102 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-F, 3-F | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 103 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 104 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 105 | NH ₂ | 1-HO-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 106 | NMe ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | -O- | |
| 107a | Morpholino | 1-F-i-Pr | Me | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -O- | |
| 108 | NHAc | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 109 | NHNH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 110 | NHPiperidino | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 111 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 112 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | Me | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 113 | NH ₂ | t1 | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 114 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 115 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 116 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 117 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 118 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-F, 3-F | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 119 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | CH ₂ OMe | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 120 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 121 | NH ₂ | 1-HO-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 122 | NMe ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 123 | Morpholino | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 124 | NHAc | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 125 | NHNH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 126 | NHPiperidino | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 127 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 128a | NHPiperidino | 1-F-i-Pr | H | H | 2-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -O- | |
| 129 | NH ₂ | t1 | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CHMe- | -O- | |
| 130 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NH- | |
| 131 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NMe- | |

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|------|--------------------------------|-----------------------------------|----------------|----------------|--------------------------------|----------------|-------------------------------------|-------------------------------------|----------|
| 132 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NH- | |
| 133 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NAc- | |
| 134 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | 1-F, 3-F | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NBz- | |
| 135 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NH- | |
| 136 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NO- | |
| 137 | NH ₂ | 1-HO-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NH- | |
| 138 | NMe ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NPh- | |
| 139 | Morpholino | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NEt- | |
| 140 | NHAc | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -N-i-Pr- | |
| 141 | NHNH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -N-n-Pr- | |
| 142 | NHPiperidino | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NH- | |
| 143 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -NH- | |
| 144 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -N(CH ₃) ₂ - | |
| 145 | NH ₂ | t1 | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CHMe- | -NPh- | |
| 146 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 147 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 148 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 149 | NH ₂ | 2-CF ₃ -Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 150 | NHPiperidino | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 151 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Ph | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 152 | NH ₂ | t-Bu | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 153 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Ph, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 154a | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2,3,4-Me ₃ | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 155 | NH ₂ | 3-CF ₃ -Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 156 | NH ₂ | CFCICF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 157 | NH ₂ | F-i-Pr | Me | Me | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 158 | NH ₂ | Me | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 159 | NH ₂ | CF ₂ CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 160 | NH ₂ | Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CMeH-CH ₂ - | | |
| 161 | NH ₂ | CF ₂ Me | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 162 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 163 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 164 | NH ₂ | CCl ₃ | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 165 | NH ₂ | CF ₂ Ph | H | H | 3-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 166 | NH ₂ | CH ₂ COOMe | H | H | 3-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 167 | NH ₂ | CH ₂ CN | H | H | 2-Et | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 168 | NH ₂ | CHMeCN | H | H | 2-Et, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 169 | NH ₂ | 1-OMe-Et | H | H | 2-Et, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 170 | NH ₂ | 2-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 171 | NH ₂ | 3-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 172 | NH ₂ | 4-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 173 | NH ₂ | 2-Me-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 174 | NH ₂ | 2-Et-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 175 | NH ₂ | 2-OH-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 176 | NH ₂ | 2-OMe-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 177 | NH ₂ | 2-CN-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 178 | NH ₂ | 2,4-F ₂ -Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 179 | NH ₂ | 1-F-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |

54

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|------|--------------------------------|-----------------------------------|----------------|----------------|--------------------------------|----------------|-------------------------------------|----------------|-----------|
| 180 | NH ₂ | epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 181 | NH ₂ | 1-Me-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 182 | NH ₂ | 1,2-Me ₂ -epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 183 | NH ₂ | 1,2,2-Me ₃ -epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 184 | NH ₂ | 1-Me-2-Et-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 185 | NH ₂ | 1-Me-2-n-Bu-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 186 | NH ₂ | 2-Me-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 187 | NH ₂ | t1 | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 188 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 189 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 190 | NH ₂ | MeO-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 191 | NH ₂ | 1-HO-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 192 | NH ₂ | 1-MeO-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 193 | NH ₂ | 1-F-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 194 | NH ₂ | 1-Cl-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 195 | NH ₂ | 1-Aco-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 196 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 197 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | 3-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 198 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 199a | NH ₂ | CHFCF ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | f. Schaum |
| 200 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | 166 - 169 |
| 201 | NH ₂ | CF ₃ | Ac | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 202 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 203 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ - | -O- | |
| 204 | NH ₂ | t-Bu | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 205a | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | H | - | -CHMeCH ₂ - | - | |
| 206 | NH ₂ | F-i-Pr | Bz | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 207 | NH ₂ | CF ₃ | H | Me | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 208 | NH ₂ | CFCICF ₂ H | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 209 | NH ₂ | F-i-Pr | Ph | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 210 | NH ₂ | Me | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 211 | NH ₂ | CF ₂ CF ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 212 | NH ₂ | Et | H | H | H | - | -CMeH-CH ₂ - | - | |
| 213 | NH ₂ | CF ₂ Me | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 214 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 215 | NH ₂ | F-i-Pr | CHO | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 216 | NH ₂ | CCl ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 217 | NH ₂ | CF ₂ Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 218 | NH ₂ | CH ₂ COOMe | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 219 | NH ₂ | CH ₂ CN | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 220 | NH ₂ | CHMeCN | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 221 | NH ₂ | 1-OMe-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 222 | NH ₂ | 2-F-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 223 | NH ₂ | 3-F-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 224 | NH ₂ | 4-F-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|------|--------------------------------|-----------------------------------|---------------------|---------------------|--------------------------------|-----------------|-------------------------------------|-----------------|-----------|
| 225 | NH ₂ | 2-Me-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 226 | NH ₂ | 2-Et-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 227 | NH ₂ | 2-OH-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 228 | NH ₂ | 2-OMe-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 229 | NH ₂ | 2-CN-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 230 | NH ₂ | 2-F4-F-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 231 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 232 | NH ₂ | epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | f. Schaum |
| 233 | NH ₂ | 1-Me-epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 234 | NH ₂ | 1,2-Me ₂ -epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 235 | NH ₂ | 1,2,2-Me ₃ -epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 236 | NH ₂ | 1-Me-2-Et-epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 237 | NH ₂ | 1-Me-2-n-Bu-epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 238 | NH ₂ | 2-Me-epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 239 | NH ₂ | t1 | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 240 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 241 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 242 | NH ₂ | MeO-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 243 | NH ₂ | 1-HO-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 244a | NH ₂ | 1-PhO-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 245 | NH ₂ | 1-F-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 246 | NH ₂ | 1-Cl-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 247 | NH ₂ | 1-Aco-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 248 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | CH ₂ OMe | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 249 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | CH ₂ OMe | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 250 | NH ₂ | Et | H | Me | H | - | CH ₂ | O | |
| 251 | NH ₂ | 1-Cl-Et | H | H | H | - | CH ₂ | NMe | |
| 252 | NH ₂ | 1-MeO-Et | H | H | 1-Me, 4-Me | CH ₂ | CH ₂ | O | |
| 253 | NH ₂ | 2-MeO-Et | H | H | 1-Me, 4-F | - | CHMeCH ₂ | | |
| 254 | NH ₂ | c-Pr | Me | COOMe | 2-Me, 4-Cl | - | CH ₂ CPhH | O | |
| 255 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | Me | CN | 2-Me, 4-Me | - | CH ₂ | CH ₂ | |
| 256 | NH ₂ | 1-F-c-Pr | Ac | Ac | 2-Me, 4-Me | - | CH ₂ | CH ₂ | |
| 257 | NH ₂ | 1-Cl-c-Pr | CHO | Me | 2-Me, 4-Me | - | CH ₂ | CH ₂ | |
| 258 | NMe ₂ | Me | H | H | 2-Me, 4-Me | - | CH ₂ | CH ₂ | |
| 259 | NHCHO | F-i-Pr | CH ₂ OMe | H | 2-Me, 4-CF ₃ | CH ₂ | CH ₂ | | |
| 260 | Morpholino | F-i-Pr | Bz | Me | 1-Me, 4-OMe | - | CH ₂ -CHMe | NMe | |
| 261 | Piperidino | F-i-Pr | H | H | 3-OMe | - | CH ₂ -CH ₂ | CHMe | |
| 262 | NHAc | F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | CH ₂ -CPhH | - | |
| 263 | NHNH ₂ | OH-i-Pr | Me | H | 3-Me, 4-Me | - | CH ₂ -CHMe | S | |
| 264 | NET ₂ | OH-i-Pr | H | H | 3-Me, 4-Et | - | CHMe-CH ₂ | S | |
| 265 | NHPh | OH-i-Pr | H | H | 2-Ac, 4-Me | CO | CH ₂ -CH ₂ | S | |
| 266 | NHBz | OMe-i-Pr | H | H | 3-OPh | CHMe | CH ₂ -CH ₂ | S | |
| 267 | NHCOPh | Me | H | H | 3-OCOPh | CHEt | CH ₂ -CH ₂ | O | |
| 268 | NH ₂ | CF ₃ | 4-Cl-Bz | H | 2-Me, 4-Me | - | CH ₂ -CH ₂ | O | |
| 269 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | Me | 2-Me, 4-Me | - | CH ₂ -CH ₂ | S | |

56

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|-----|--------------------------------|-----------------------------------|----------------|----------------|--------------------------------|--------------------|-------------------------------------|----------------|-----------|
| 270 | NH ₂ | CH ₂ CF ₃ | H | Et | 2-Me, 4-Me | - | CH ₂ -CH ₂ | S | |
| 271 | NH ₂ | 1-CF ₃ -c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | CH ₂ -CH ₂ | S | |
| 272 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 273 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 274 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 275 | NH ₂ | CF ₃ | 3-Cl-Bz | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 276 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | Et | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 277 | NH ₂ | F-i-Pr | H | Me | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | O- | |
| 278 | NH ₂ | t-Bu | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 279 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | Me | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 280 | NHNH-Ph | F-i-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 281 | NH ₂ | CF ₃ | 4-Cl-Bz | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 282 | NH ₂ | CFCICF ₂ H | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 283 | NH ₂ | F-i-Pr | H | Ac | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 284 | NH ₂ | Me | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 285 | NH ₂ | CF ₂ CF ₃ | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 286 | NH ₂ | Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 287 | NH ₂ | CF ₂ Me | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 288 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 289 | NH ₂ | F-i-Pr | H | Et | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 290 | NH ₂ | CCl ₃ | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 291 | NH ₂ | CF ₂ Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 292 | NH ₂ | CH ₂ COOMe | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 293 | NH ₂ | CH ₂ CN | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 294 | NH ₂ | CHMeCN | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 295 | NH ₂ | 1-OMe-Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 296 | NH ₂ | 2-F-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 297 | NH ₂ | 3-F-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 298 | NH ₂ | 4-F-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 299 | NH ₂ | 2-Me-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 300 | NH ₂ | 2-Et-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 301 | NH ₂ | 2-OH-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 302 | NH ₂ | 2-OMe-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 303 | NH ₂ | 2-CN-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 304 | NH ₂ | 2,4-F ₂ -Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 305 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | 153-154 |
| 306 | NH ₂ | epoxid | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 307 | NH ₂ | 1-Me-epoxid | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 308 | NH ₂ | 1,2-Me ₂ -epoxid | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 309 | NH ₂ | 1,2,2-Me ₃ -epoxid | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 310 | NH ₂ | 1-Me-2-Et- | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 311 | NH ₂ | epoxid | 1-Me-2-n-Bu- | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 312 | NH ₂ | epoxid | 2-Me-epoxid | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 313 | NH ₂ | t1 | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 314 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | 145 - 146 |

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|------|--------------------------------|-----------------------------------|-----------------------------------|----------------|--------------------------------|---------------------|-------------------------------------|----------------|----------|
| 315 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 316 | NH ₂ | MeO-i-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 317 | NH ₂ | 1-HO-Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 318 | NH ₂ | 1-MeO-Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 319 | NH ₂ | 1-F-Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 320 | NH ₂ | 1-Cl-Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 321 | NH ₂ | 1-AcO-Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 322 | NH ₂ | HO-i-Pr | CH ₂ CN | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 323 | NH ₂ | Cl-i-Pr | CH ₂ CH ₂ - | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| | | | -CN | | | | | | |
| 324 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 325 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 326 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 327 | NH ₂ | CF ₃ | CH ₂ OMe | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 328 | NH-c-Pr | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 329 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | O- | |
| 330 | NH ₂ | t-Bu | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 331 | NHNH-Me | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 332 | NH ₂ | F-i-Pr | CH ₂ OMe | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 333a | NHMe | CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 334 | NH ₂ | CFCICF ₂ H | H | Me | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 335 | NH ₂ | F-i-Pr | Et | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 336 | NH ₂ | Me | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 337 | NH ₂ | CF ₂ CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 338 | NH ₂ | Et | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 339 | NH ₂ | CF ₂ Me | H | H | 1-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 340 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 1-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 341 | NH ₂ | F-i-Pr | H | Me | 1-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 342 | NH ₂ | CCl ₃ | H | H | 3-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 343 | NH ₂ | CF ₂ Ph | H | H | 3-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 344 | NH ₂ | CH ₂ COOMe | H | H | 3-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 345 | NH ₂ | CH ₂ CN | H | H | 2-Et | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 346 | NH ₂ | CHMeCN | H | H | 2-Et, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 347 | NH ₂ | 1-OMe-Et | H | H | 2-Et, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 348 | NH ₂ | 2-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 349 | NH ₂ | 3-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 350 | NH ₂ | 4-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 351 | NH ₂ | 2-Me-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 352 | NH ₂ | 2-Et-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CMe ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 353 | NH ₂ | 2-OH-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | CMeH- | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 354 | NH ₂ | 2-OMe-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 355 | NH ₂ | 2-CN-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 356 | NH ₂ | 2,4-F ₂ -Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 357 | NH ₂ | 1-F-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | CHOH | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 358 | NH ₂ | epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 359 | NH ₂ | 1-Me-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 360 | NH ₂ | 1,2-Me ₂ -epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 361 | NH ₂ | 1,2,2-Me ₃ - | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| | | epoxid | | | | | | | |

58

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁶ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|-----|--------------------------------|-----------------------------------|----------------|---------------------|--------------------------------|--------------------|-------------------------------------|----------------|-----------|
| 362 | NH ₂ | 1-Me-2-Et-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 363 | NH ₂ | 1-Me-2-n-Bu-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 364 | NH ₂ | 2-Me-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 365 | NH ₂ | t1 | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 366 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 367 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 368 | NH ₂ | MeO-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 369 | NH ₂ | 1-HO-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 370 | NH ₂ | 1-MeO-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 371 | NH ₂ | 1-F-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 372 | NH ₂ | 1-Cl-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 373 | NH ₂ | 1-AcO-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 374 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 375 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | 3-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ -CH ₂ - | - | |
| 376 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 377 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 378 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 379 | NH ₂ | CF ₃ | H | CH ₂ OMe | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | 168 - 170 |
| 380 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | CH ₂ OMe | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 381 | NH ₂ | F-i-Pr | H | CH ₂ OMe | H | -CO- | -CH ₂ - | | |
| 382 | NH ₂ | t-Bu | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 383 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | Me | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 384 | NH ₂ | F-i-Pr | H | CH ₂ OMe | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 385 | NH ₂ | CF ₃ | H | Me | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 386 | NH ₂ | CFCICF ₂ H | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 387 | NH ₂ | F-i-Pr | H | Ph | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 388 | NH ₂ | Me | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 389 | NH ₂ | CF ₂ CF ₃ | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 390 | NH ₂ | Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 391 | NH ₂ | CF ₂ Me | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 392 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | Bz | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 393 | NH ₂ | F-i-Pr | H | i-Pr | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 394 | NH ₂ | CCl ₃ | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 395 | NH ₂ | CF ₂ Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 396 | NH ₂ | CH ₂ COOMe | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 397 | NH ₂ | CH ₂ CN | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 398 | NH ₂ | CHMeCN | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 399 | NH ₂ | 1-OMe-Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 400 | NH ₂ | 2-F-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 401 | NH ₂ | 3-F-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 402 | NH ₂ | 4-F-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 403 | NH ₂ | 2-Me-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 404 | NH ₂ | 2-Et-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 405 | NH ₂ | 2-OH-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 406 | NH ₂ | 2-OMe-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |
| 407 | NH ₂ | 2-CN-Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | | |

59

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|------|--------------------------------|-----------------------------------|---------------------|----------------|--------------------------------|--------------------|--------------------------------|----------------|-----------|
| 408 | NH ₂ | 2,4-F ₂ -Ph | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 409 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 410 | NH ₂ | epoxid | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | 120 - 123 |
| 411 | NH ₂ | 1-Me-epoxid | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 412 | NH ₂ | 1,2-Me ₂ -epoxid | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 413 | NH ₂ | 1,2,2-Me ₃ -epoxid | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 414 | NH ₂ | 1-Me-2-Et-epoxid | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 415 | NH ₂ | 1-Me-2-n-Bu-epoxid | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 416 | NH ₂ | 2-Me-epoxid | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 417 | NH ₂ | t1 | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 418 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 419 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | 188 - 190 |
| 420 | NH ₂ | MeO-i-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 421 | NH ₂ | 1-HO-Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 422 | NH ₂ | 1-MeO-Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 423 | NH ₂ | 1-F-Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 424 | NH ₂ | 1-Cl-Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 425 | NH ₂ | 1-AcO-Et | H | H | H | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 426 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CHPh- | - | |
| 427 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | H | -CH ₂ - | -CHPh- | - | |
| 428 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 429 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | Me | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 430 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 431 | NH ₂ | CF ₃ | Me | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 432 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 433 | NH ₂ | F-i-Pr | Me | H | 2-Me, | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 434 | NH ₂ | t-Bu | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 435 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | Ac | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 436 | NH ₂ | F-i-Pr | Et | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 437a | NH-i-Pr | CF ₃ | CH ₂ OMe | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 438 | NH ₂ | CFCICF ₂ H | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 439 | NH ₂ | F-i-Pr | Ac | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 440 | NH ₂ | Me | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 441 | NH ₂ | CF ₂ CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 442 | NH ₂ | Et | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 443 | NH ₂ | CF ₂ Me | H | H | 1-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 444 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 1-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 445 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 446 | NH ₂ | CCl ₃ | H | H | 3-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 447 | NH ₂ | CF ₂ Ph | H | H | 3-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 448 | NH ₂ | CH ₂ COOMe | H | H | 3-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 449 | NH ₂ | CH ₂ CN | H | H | 2-Et | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 450 | NH ₂ | CHMeCN | H | H | 2-Et, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 451 | NH ₂ | 1-OMe-Et | H | H | 2-Et, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 452 | NH ₂ | 2-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |

60

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|-----|--------------------------------|-----------------------------------|----------------|----------------|--------------------------------|---------------------|--------------------------------|----------------|----------|
| 453 | NH ₂ | 3-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 454 | NH ₂ | 4-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 455 | NH ₂ | 2-Me-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 456 | NH ₂ | 2-Et-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CMe ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 457 | NH ₂ | 2-OH-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ - | - | |
| | | | | | | CMeH- | | | |
| 458 | NH ₂ | 2-OMe-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 459 | NH ₂ | 2-CN-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 460 | NH ₂ | 2-F4-F-Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 461 | NH ₂ | 1-F-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ - | - | |
| | | | | | | COHH- | | | |
| 462 | NH ₂ | epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 463 | NH ₂ | 1-Me-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 464 | NH ₂ | 1-Me-2-Me- | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| | | epoxid | | | | | | | |
| 465 | NH ₂ | 1,2,2-Me ₃ - | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| | | epoxid | | | | | | | |
| 466 | NH ₂ | 1-Me-2-Et- | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| | | epoxid | | | | | | | |
| 467 | NH ₂ | 1-Me-2-n-Bu- | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| | | epoxid | | | | | | | |
| 468 | NH ₂ | 2-Me-epoxid | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 469 | NH ₂ | t1 | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 470 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 471 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 472 | NH ₂ | MeO-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 473 | NH ₂ | 1-HO-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 474 | NH ₂ | 1-MeO-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 475 | NH ₂ | 1-F-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 476 | NH ₂ | 1-Cl-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 477 | NH ₂ | 1-AcO-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 478 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 479 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | 3-Me, 4-Me | -CH ₂ - | -CH ₂ - | - | |
| 480 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 481 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 482 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 483 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -S- | |
| 484 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CHPh- | -S- | |
| 485 | NH ₂ | F-i-Pr | H | Me | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CHPh- | -S- | |
| 486 | NH ₂ | t-Bu | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 487 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | Me | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 488 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Me | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 489 | NHAc | CF ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 490 | NEt ₂ | CFCICF ₂ H | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 491 | NH ₂ | F-i-Pr | H | Ac | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 492 | NH ₂ | Me | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 493 | NH ₂ | CF ₂ CF ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 494 | NH ₂ | Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|------|--------------------------------|-----------------------------------|----------------|----------------|--------------------------------|----------------|-------------------------------------|--------------------|----------|
| 495 | NH ₂ | CF ₂ Me | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 496 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | 4-Cl-Bz | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 497 | NH ₂ | F-i-Pr | H | Et | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 498 | NH ₂ | CCl ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 499 | NH ₂ | CF ₂ Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 500 | NH ₂ | CH ₂ COOMe | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 501 | NH ₂ | CH ₂ CN | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 502 | NH ₂ | CHMeCN | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 503 | NH ₂ | 1-OMe-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 504 | NH ₂ | 2-F-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 505 | NH ₂ | 3-F-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 506 | NH ₂ | 4-F-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 507 | NH ₂ | 2-Me-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 508 | NH ₂ | 2-Et-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 509 | NH ₂ | 2-OH-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 510 | NH ₂ | 2-OMe-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 511 | NH ₂ | 2-CN-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 512 | NH ₂ | 2,4-F ₂ -Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 513 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 514 | NH ₂ | epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 515 | NH ₂ | 1-Me-epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 516 | NH ₂ | 1,2-Me ₂ -epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 517 | NH ₂ | 1,2,2-Me ₃ -epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 518 | NH ₂ | 1-Me-2-Et-epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 519 | NH ₂ | 1-Me-2-n-Bu-epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 520 | NH ₂ | 2-Me-epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 521 | NH ₂ | t1 | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 522 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 523 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 524 | NH ₂ | MeO-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 525 | NH ₂ | 1-HO-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 526 | NH ₂ | 1-MeO-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 527 | NH ₂ | 1-F-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 528 | NH ₂ | 1-Cl-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 529 | NH ₂ | 1-AcO-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 530 | NMe ₂ | HO-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 531 | NHBz | Cl-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CHPh- | -O- | |
| 532 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 533 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 534 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 535 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 2-thien-2-yl | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 536a | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | Me | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 537 | NH ₂ | F-i-Pr | H | Me | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 538a | NH ₂ | t-Bu | Me | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 539 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | Me | 2-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |

62

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|------|--------------------------------|-----------------------------------|----------------|----------------|--------------------------------|----------------|-------------------------------------|--------------------|----------|
| 540 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 2-Me, | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 541a | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CHPh- | |
| 542 | NH ₂ | CFCICF ₂ H | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 543 | NH ₂ | F-i-Pr | H | Ac | 3-OMe | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 544 | NH ₂ | Me | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 545 | NH ₂ | CF ₂ CF ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 546 | NH ₂ | Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 547 | NH ₂ | CF ₂ Me | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 548 | NH ₂ | CF ₂ CF ₂ H | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 549 | NH ₂ | F-i-Pr | H | Et | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 550 | NH ₂ | CCl ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 551 | NH ₂ | CF ₂ Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 552 | NH ₂ | CH ₂ COOMe | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 553 | NH ₂ | CH ₂ CN | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 554 | NH ₂ | CHMeCN | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 555 | NH ₂ | 1-OMe-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 556 | NH ₂ | 2-F-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 557 | NH ₂ | 3-F-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 558 | NH ₂ | 4-F-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 559 | NH ₂ | 2-Me-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 560 | NH ₂ | 2-Et-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 561 | NH ₂ | 2-OH-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 562 | NH ₂ | 2-OMe-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 563 | NH ₂ | 2-CN-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 564 | NH ₂ | 2-F4-F-Ph | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 565 | NH ₂ | 1-Me-c-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 566 | NH ₂ | epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 567 | NH ₂ | 1-Me-epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 568 | NH ₂ | 1,2-Me ₂ -epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 569 | NH ₂ | 1,2,2-Me ₃ -epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 570 | NH ₂ | 1-Me-2-Et-epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 571 | NH ₂ | 1-Me-2-n-Bu-epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 572 | NH ₂ | 2-Me-epoxid | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 573 | NH ₂ | t1 | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 574 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 575 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 576 | NH ₂ | MeO-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 577 | NH ₂ | 1-HO-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 578 | NH ₂ | 1-MeO-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 579 | NH ₂ | 1-F-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 580 | NH ₂ | 1-Cl-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 581 | NH ₂ | 1-AcO-Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 582 | NH ₂ | HO-i-Pr | H | H | H | CO | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 583 | NH ₂ | Cl-i-Pr | H | H | H | CO | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 584 | NH ₂ | 1-OH-2-Me-O-Et | H | H | 2-Me-4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |

63

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | [Y ²] _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|-----|--------------------------------|---|----------------|----------------|--------------------------------|----------------|------------------------------------|--------------------|----------|
| 585 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 3-MeO, 4-F | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 586 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 1-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | S | 176-178 |
| 587 | NH ₂ | i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | fest |
| 588 | NH ₂ | CH ₂ CH(OH)- | H | 2-Me, | - | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | fest |
| | | CF ₃ H | | 4-Me | | | | | |
| 589 | NH ₂ | -CMe=CH ₂ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | 156-157 |
| 590 | NH ₂ | Me | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | 100-101 |
| 591 | NH ₂ | CH ₂ -CMe ₂ OMe | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | fest |
| 592 | NH ₂ | CH ₂ -OMe | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | 198-199 |
| 593 | NH ₂ | CH ₂ -t-Bu | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 594 | NH ₂ | NH ₂ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 595 | NH ₂ | OMe | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 596 | NH ₂ | SMe | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | 180-182 |
| 597 | NH ₂ | SEt | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 598 | NH ₂ | 1-F-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 599 | NH ₂ | CH ₂ CH(OMe)- | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | 65-70 |
| | | CF ₃ | | | | | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 600 | NH ₂ | CH ₂ CH(OMe)- | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | - | fest |
| | | CF ₃ | | | | | | | |
| 601 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ CH ₂ - | -O- | 191-193 |
| 602 | NH ₂ | CHCF ₃ CH ₂ OMe | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 603 | NH ₂ | CHMeCH ₂ OMe | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 604 | NH ₂ | 1-Me-c-Bu | H | H | H | - | -CH ₂ CH ₂ - | - | 148-150 |
| 605 | NH ₂ | 1-Me-c-Bu | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | fest |
| 606 | NH ₂ | CH ₂ CH ₂ CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | 55-60 |
| 607 | NH ₂ | CHMeCH ₂ CF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | fest |
| 608 | NH ₂ | CMe=CHCF ₃ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 609 | NH ₂ | CH ₂ CH ₂ CF ₃ | H | H | H | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | fest |
| 610 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 2-F | - | -CH ₂ CH ₂ - | - | 86-90 |
| 611 | NH ₂ | C(OH)Et ₂ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -S- | 149-150 |
| 612 | NH ₂ | 1-F-c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | fest |
| 613 | NH ₂ | 2,2,3,3-Me ₄ -c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -O- | 215-220 |
| | | | | | | | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 614 | NH ₂ | 1-Et-c-Bu | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 615 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ - | -CHPh- | 93-95 |
| 616 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -O- | 214-216 |
| 617 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | - | 140-144 |
| 618 | NH ₂ | CHOHPh | H | H | H | - | -CH ₂ CH ₂ - | - | |
| 619 | NH ₂ | CHOHPh | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 620 | NH ₂ | CH ₂ OMe | H | H | H | - | -CH ₂ CH ₂ - | - | 197-198 |
| 621 | NH ₂ | CH ₂ OMe | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -O- | 180-182 |
| 622 | NH ₂ | CH ₂ CH ₂ - | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | fest |
| | | CH=CH ₂ | | | | | | | |
| 623 | NH ₂ | CH(OMe)Ph | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | fest |
| 624 | NH ₂ | CH ₂ -c-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | fest |
| 625 | NH ₂ | -5-Isoxazolyl | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | fest |
| 626 | NH ₂ | i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | - | fest |
| 627 | NH ₂ | NMe ₂ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ CH ₂ - | -CH ₂ - | 155-160 |

64

| Nr. | NR ¹ R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | (R ⁶) _n | Y ¹ | (Y ²) _m | Y ³ | Fp. (°C) |
|-----|--------------------------------|-------------------------------------|----------------|----------------|--------------------------------|----------------|-------------------------------------|--------------------|----------|
| 628 | NMePh | F | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 146-148 |
| 629 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH(3,5- | -CH ₂ - | fest |
| 630 | NH ₂ | i-Pr | H | H | H | - | Me ₂ -Bz) | | |
| 631 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 2-MeO | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 173-175 |
| 632 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 4-MeO, 2-F | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 172-173 |
| 633 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 4-MeO, 2-F | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 634 | NH ₂ | c-Pr | H | H | 4-MeO | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 89-94 |
| 635 | NH ₂ | CH ₂ OMe | H | H | 4-MeO | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 158-160 |
| 636 | NH ₂ | Et | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | 175-178 |
| 637 | NH ₂ | Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 76-80 |
| 638 | NH ₂ | CHOMe-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | fest |
| 639 | NH ₂ | CH ₂ Bz | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | 96-98 |
| 640 | NH ₂ | CH ₂ Bz | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 70-74 |
| 641 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 642 | NH ₂ | CF ₃ | H | H | 1-Me, 3-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 643 | NH ₂ | n-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 75-77 |
| 644 | NH ₂ | n-Pentyl | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 62-64 |
| 645 | NH ₂ | c-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 646 | NH ₂ | 1-F-i-Pr | H | H | 2-F | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 647 | NH ₂ | Cl | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 225-226 |
| 648 | NH ₂ | CH ₂ -CH=CH ₂ | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | |
| 649 | NH ₂ | NMe ₂ | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | 173-174 |
| 650 | NH ₂ | OCH ₂ CCH | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 651 | NH ₂ | 1-EtO-Et | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | |
| 652 | NH ₂ | CH ₂ -c-i-Pr | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 78-80 |
| 653 | NH ₂ | CH ₂ -c-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | 65-67 |
| 654 | NH ₂ | CH ₂ -c-Hexyl | H | H | H | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | 70-75 |
| 655 | NH ₂ | CH ₂ -c-Hexyl | H | H | 2-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | -CH ₂ - | 75-80 |
| 656 | NH ₂ | i-Pr | H | H | 3-Me, 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | 190-191 |
| 657 | NH ₂ | i-Pr | H | H | 4-Me | - | -CH ₂ -CH ₂ - | | 60-65 |
| 658 | NH ₂ | F-i-Pr | H | H | H | - | -CH ₂ CHPh- | -O- | 104-105 |

B. Formulierungsbeispiele

- a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.
- b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I), 64 Gewichtsteile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gewichtsteile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.
- c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man 20 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I) mit 6 Gew.-Teilen Alkylphenolpolyglykolether (Triton X 207), 3 Gew.-Teilen Isotridecanolpolyglykolether (8 EO) und 71 Gew.-Teilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B. ca. 255 bis über 277°C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.
- d) Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 15 Gew.-Teilen einer Verbindung der Formel (I), 75 Gew.-Teilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertes Nonylphenol als Emulgator.
- e) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird erhalten indem man 75 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I),
10 " ligninsulfonsaures Calcium,
5 " Natriumlaurylsulfat,
3 " Polyvinylalkohol und
7 " Kaolin
mischt, auf einer Stiftmühle mahlt und das Pulver in einem Wirbelbett durch Aufsprühen von Wasser als Granulierflüssigkeit granuliert.

- f) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird auch erhalten, indem man
25 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I),

5 " 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium

2 " oleoylmethyltaurinsaures Natrium,

1 Gewichtsteil Polyvinylalkohol,

17 Gewichtsteile Calciumcarbonat und

50 " Wasser

auf einer Kolloidmühle homogenisiert und vorzerkleinert, anschließend auf einer Perlzmühle mahlt und die so erhaltene Suspension in einem Sprühturm mittels einer Einstoffdüse zerstäubt und trocknet.

C. Biologische Beispiele

1. Unkrautwirkung im Vorauflauf

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Unkrautpflanzen werden in Plastiktöpfen in sandiger Lehmerde ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Die in Form von benetzbaren Pulvern oder Emulsionskonzentraten formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden dann als wässrige Suspension bzw. Emulsion mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 l/ha in unterschiedlichen Dosierungen auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert. Nach der Behandlung werden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Unkräuter gehalten. Die optische Bonitur der Pflanzen- bzw. Auflaufschäden erfolgt nach dem Auflaufen der Pflanzen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen. Wie die Testergebnisse zeigen, weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen eine gute herbizide Vorauflaufwirksamkeit gegen ein breites Spektrum von Ungräsern und Unkräutern auf. Beispielsweise zeigen die Beispiele Nr. 2, 3, 38, 43, 199, 200, 231, 240, 482 (s. Tabelle 1) im Test sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen wie *Sinapis alba*, *Chrysanthemum segetum*, *Avena sativa*, *Stellaria media*, *Echinochloa crus-galli*, *Lolium multiflorum*, *Setaria spp.*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*.

und *Panicum miliaceum* im Vorauflaufverfahren bei einer Aufwandmenge von 0,5 kg und weniger Aktivsubstanz pro Hektar.

2. Unkrautwirkung im Nachauflauf

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Unkräutern werden in Plastiktöpfen in sandigem Lehmboden ausgelegt, mit Erde abgedeckt und im Gewächshaus unter guten Wachstumsbedingungen angezogen. Drei Wochen nach der Aussaat werden die Versuchspflanzen im Dreiblattstadium behandelt. Die als Spritzpulver bzw. als Emulsionskonzentrate formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden in verschiedenen Dosierungen mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 l/ha auf die grünen Pflanzenteile gesprüht. Nach ca. 3 bis 4 Wochen Standzeit der Versuchspflanzen im Gewächshaus unter optimalen Wachstumsbedingungen wird die Wirkung der Präparate optisch im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen bonitiert. Die erfindungsgemäßen Mittel weisen auch im Nachauflauf eine gute herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger Ungräser und Unkräuter auf. Beispielsweise zeigen die Beispiele Nr. 2, 3, 38, 43, 199, 200, 231, 240, 482 (s. Tabelle 1) im Test sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen wie *Sinapis alba*, *Echinochloa crus-galli*, *Lolium multiflorum*, *Chrysanthemum segetum*, *Setaria spp.*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus* und *Panicum miliaceum*, *Avena sativa* im Nachauflaufverfahren bei einer Aufwandmenge von 0,5 kg und weniger Aktivsubstanz pro Hektar.

3. Wirkung auf Schadpflanzen in Reis

Verpflanzter und gesäter Reis sowie typische Reisunkräuter werden im Gewächshaus bis zum Dreiblattstadium (*Echinochloa* 1,5-Blatt) unter Paddyreis-Bedingungen (Anstauhöhe des Wassers: 2 - 3 cm) in geschlossenen Plastiktöpfen angezogen. Danach erfolgt die Behandlung mit den

erfindungsgemäßen Verbindungen. Hierzu werden die formulierten Wirkstoffe in Wasser suspendiert, gelöst bzw. emulgiert und mittels Gießapplikation in das Anstauwasser der Testpflanzen in unterschiedlichen Dosierungen ausgebracht. Nach der so durchgeführten Behandlung werden die Versuchspflanzen im Gewächshaus unter optimalen Wachstumsbedingungen aufgestellt und während der gesamten Versuchszeit so gehalten. Etwa drei Wochen nach der Applikation erfolgt die Auswertung mittels optischer Bonitur der Pflanzenschäden im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen, wobei beispielsweise die Verbindungen Nr. 2, 3, 38, 43, 199, 200, 231, 240, 482 (s. Tab. 1) sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen zeigen, die typisch für Reiskulturen sind, wie z.B. *Cyperus monti*, *Echinochloa crus-galli*, *Eleocharis acicularis* und *Sagittaria pygmaea*.

4. Kulturpflanzenverträglichkeit

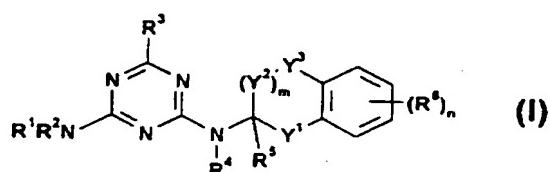
In weiteren Versuchen im Gewächshaus werden Samen einer größeren Anzahl von Kulturpflanzen und Unkräutern in sandigem Lehmboden ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Ein Teil der Töpfe wird sofort wie unter Abschnitt 1 beschrieben behandelt, die übrigen im Gewächshaus aufgestellt, bis die Pflanzen zwei bis drei echte Blätter entwickelt haben und dann wie unter Abschnitt 2 beschrieben mit den erfindungsgemäßen Substanzen der Formel (I') in unterschiedlichen Dosierungen besprüht. Vier bis fünf Wochen nach der Applikation und Standzeit im Gewächshaus wird mittels optischer Bonitur festgestellt, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen zweikeimblättrige Kulturen wie z.B. Soja, Baumwolle, Raps, Zuckerrüben und Kartoffeln im Vor- und Nachlaufverfahren selbst bei hohen Wirkstoffdosierungen ungeschädigt lassen. Einige Substanzen schonen darüber hinaus auch Gramineen-Kulturen wie z.B. Gerste, Weizen, Roggen, Sorghum-Hirschen, Mais oder Reis. Unter anderen zeigen die Verbindungen Nr. 2, 3, 38, 43, 199, 200, 231, 240, 482 der Tabelle 1 entsprechend der Formel (I') zeigen teilweise eine hohe

69

**Selektivität und eignen sich deshalb zur Bekämpfung von unerwünschten
Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Kulturen.**

Patentansprüche

1. Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze,



worin

R^1 und R^2 jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 10 C-Atomen oder einen Heterocyclrest, Heterocyclxyrest, Heterocyclthiorest oder Heterocyclaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder einen Acylrest oder

R^1 und R^2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^1R^2 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 4 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom die gegebenenfalls weiteren Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S ausgewählt sind und der Rest unsubstituiert oder substituiert ist,

R^3 Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro oder einen Rest der Formel $-Z^1-R^7$,

R^4 Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 10 C-Atomen oder einen Heterocyclrest, Heterocyclxyrest oder Heterocyclaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder einen Acylrest,

R^5 Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro oder einen Rest der Formel $-Z^2-R^8$,

R^6 , wenn $n = 1$, oder die Reste R^6 jeweils unabhängig voneinander, wenn n größer als 1 ist, Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro oder eine Gruppe der Formel $-Z^3-R^9$,

R^7 , R^8 , R^9 jeweils unabhängig voneinander

- Wasserstoff oder
- einen acyclischen Kohlenwasserstoffrest, wobei in der Kette Kohlenstoffatome durch Heteroatome aus der Gruppe N, O und S substituiert sein können, oder
- einen cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder
- einen heterocyclischen Rest,

wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder substituiert ist,

Z^1 , Z^2 , Z^3 jeweils unabhängig voneinander

- eine direkte Bindung oder
- eine divalente Gruppe der Formel $-O-$, $-S(O)_p-$, $-S(O)_p-O-$, $-O-S(O)_p-$, $-CO-$, $-CS-$, $-S-CO-$, $-CO-S-$, $-O-CS-$, $-CS-O-$, $-S-CS-$, $-CS-S-$, $-OCO-$, $-CO-O-$, $-NR'$, $-O-NR'$, $-NR'-O-$, $-NR'-CO-$ oder $-CO-NR'$, wobei $p = 0$, 1 oder 2 ist und R' Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, Phenyl, Benzyl, Cycloalkyl mit 3 bis 6 C-Atomen oder Alkanoyl mit 1 bis 6 C-Atomen ist,

Y^1 , Y^2 , Y^3 und weitere Gruppen Y^2 , wenn $m = 2$, 3 oder 4 ist, jeweils unabhängig voneinander

- eine divalente Gruppe der Formel CR^aR^b , wobei R^a und R^b gleich oder verschieden sind und jeweils einen Rest aus der Gruppe der für R^7 bis R^9 möglichen Reste bedeuten, oder
- eine divalente Gruppe der Formel $-O-$, $-CO-$, $-CS-$, $-CH(OR^*)-$, $-C(=NR^*)-$, $-S(O)_q-$, $-NR^*$ oder $-N(O)-$, wobei $q = 0$, 1 oder 2 ist und R^* Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder
- Y^1 oder Y^3 eine direkte Bindung,

wobei zwei Sauerstoffatome der Gruppen Y² und Y³ nicht benachbart sind,

- m 1, 2, 3 oder 4,
- n 0, 1, 2, 3 oder 4

bedeuten.

2. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder deren Salze, dadurch gekennzeichnet, daß

R¹ und R² jeweils unabhängig voneinander

Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen im Alkylrest oder
 einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder
 Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen oder einen
 Heterocyclrest, Heterocyclyloxyrest oder Heterocyclaminorest mit
 jeweils 3 bis 9 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe
 N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder
 durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkoxy,
 (C₁-C₄)Haloalkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₂-C₄)Alkenyl, (C₂-C₄)Alkinyl,
 (C₂-C₄)Alkenyloxy, (C₂-C₄)Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino,
 Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido,
 [(C₁-C₄)Alkoxy]-carbonyl, [(C₁-C₄)Alkyl]-carbonyl, Formyl, Carbamoyl,
 Mono- und Di-[(C₁-C₄)alkyl]-aminocarbonyl, Phenylcarbonyl,
 Phenoxy carbonyl, (C₁-C₄)Alkylsulfinyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfinyl,
 (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer
 Reste, auch (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl substituiert ist oder durch
 einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Gruppe Phenyl,
 Phenoxy, Cycloalkyl, Heterocycl und Heterocyclyloxy substituiert ist,
 oder einen Acylrest oder

R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR¹R² einen
 heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2
 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere

Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,

R⁴ Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen im Alkylrest,
 einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder
 Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen oder einen
 Heterocyclrest, Heterocyclyloxyrest oder Heterocyclaminorest mit
 jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe
 N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder
 durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkoxy,
 (C₁-C₄)Haloalkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₂-C₄)Alkenyl, (C₂-C₄)Alkinyl,
 (C₂-C₄)Alkenyloxy, (C₂-C₄)Alkyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino,
 Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido,
 [(C₁-C₄)Alkoxy]-carbonyl, [(C₁-C₄)Alkyl]-carbonyl, Formyl, Carbamoyl,
 Mono- und Di-[(C₁-C₄)alkyl]-aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkylsulfinyl,
 (C₁-C₄)Haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfonyl
 und, im Falle cyclischer Reste, auch (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl
 substituiert ist oder durch einen unsubstituierten oder substituierten Rest
 aus der Gruppe Phenyl, Phenoxy, Cycloalkyl, Heterocycl und
 Heterocyclyloxy substituiert ist, oder
 einen Acylrest,

R⁷, R⁸, R⁹ jeweils unabhängig voneinander

- Wasserstoff oder
- (C₁-C₆)Alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, wobei jeder der
 letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder
 mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro
 und Reste der Formel -Z⁴-R¹⁰ substituiert ist, oder
- (C₃-C₈)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder
 mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₆)Alkyl, (C₁-
 C₆)Haloalkyl, (C₁-C₆)Haloalkoxy, (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₆)Alkylthio,

(C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, (C₃-C₄)Alkenyloxy und (C₃-C₄)Alkinyloxy substituiert ist, oder

- Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro und Reste der Formel -Z⁵-R¹¹ substituiert ist, oder
- einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 9 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Thiocyanato, Nitro und Reste der Formel -Z⁶R¹² substituiert ist, und

Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶ jeweils unabhängig voneinander

- eine direkte Bindung oder
- eine divalente Gruppe der Formel -O-, -S(O)_p-, -S(O)_p-O-, -O-S(O)_p-, -CO-, -CS-, -SCO-, -CO-S-, -OCO-, -CO-O-, -NR'-, -O-NR'-, -NR'-O-, -NR'-CO- oder -CO-NR'-, wobei p = 0, 1 oder 2 ist und R' Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, Phenyl, Benzyl, Cycloalkyl mit 3 bis 6 C-Atomen oder Alkanoyl mit 1 bis 6 C-Atomen ist, und

R¹⁰, R¹¹, R¹² jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₆)Alkyl,

(C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkoxy und (C₁-C₄)Alkylthio substituiert ist, oder (C₃-C₈)Cycloalkyl, Phenyl, Heterocyclyl mit 3 bis 9 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der letztgenannten 3 cyclischen Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder

jeweils zwei Reste -Z⁴-R¹⁰ oder -Z⁵-R¹¹ oder -Z⁶-R¹²

gemeinsam mit dem Anknüpfungselement oder den jeweiligen Anknüpfungselementen einen Cyclus mit 3 bis 8 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus

der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist, bedeuten.

3. Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß

R¹, R² unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Halo(C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Haloalkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, (C₂-C₆)Haloalkinyl, (C₁-C₄)Alkylamino-(C₁-C₄)alkyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)Alkyl]amino-carbonyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclithio, oder einen der letztgenannten 17 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Formyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl und (C₁-C₄)Alkoxy substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR¹R² einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere

Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausg wählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,

R³ Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, Formyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₈)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Halo(C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)alkylthio, (C₂-C₆)Alkenyl, Halo-(C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, Halo-(C₂-C₆)alkinyl, (C₁-C₄)Alkylamino-(C₁-C₄)alkyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 4 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)Alkyl]-amino-carbonyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocycloloxy, Heterocyclylthio oder einen der letztgenannten 17 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Formyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält,

R⁴ Wasserstoff, Amino, Formyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Halo(C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, Halo-(C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, Halo-(C₂-C₆)alkinyl, (C₁-C₄)Alkylamino-(C₁-C₄)alkyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-(C₁-C₄)alkyl,

C_4)alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkylamino-(C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C_1-C_4)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C_1-C_4)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, Phenylcarbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylamino-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl, Mono- oder Di-[(C_1-C_4)Alkyl]-amino-carbonyl, Phenoxy-(C_1-C_4)alkyl, Phenyl-(C_1-C_4)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclxy, Heterocyclthio, oder einen der letztgenannten 17 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Haloalkoxy, Formyl, (C_1-C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocycll in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält,

R^5 Wasserstoff, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, Aminocarbonyl, (C_1-C_4)Alkyl, Cyano-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylamino, Di-[(C_1-C_4)alkyl]-amino, Halo-(C_1-C_4)alkyl, Hydroxy-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl, Halo(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylthio, Halo-(C_1-C_4)alkylthio, (C_2-C_6)Alkenyl, Halo-(C_2-C_6)alkenyl, (C_2-C_6)Alkinyl, Halo-(C_2-C_6)alkinyl, (C_1-C_4)Alkylamino-(C_1-C_4)alkyl, Di-[(C_1-C_4)alkyl]-amino-(C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkylamino-(C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C_1-C_4)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C_1-C_4)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, Phenylcarbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylamino-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl, Mono- oder Di-[(C_1-C_4)Alkyl]-amino-

carbonyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyoxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 17 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Formyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl und (C₁-C₄)Alkoxy substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält,

R⁶ wenn n = 1 ist, und die Reste R⁶, jeweils unabhängig voneinander, wenn n größer als 1 ist, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Halo-(C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)alkylthio, (C₂-C₆)Alkenyl, Halo-(C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, Halo-(C₂-C₆)alkinyl, (C₁-C₄)Alkylamino-(C₁-C₄)alkyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkylamino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)Alkyl]-amino-carbonyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyoxy, Heterocyclylthio oder einen der letztgenannten 17 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Formyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl,

$(C_1-C_4)Alkoxy$, substituiert ist,
 wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3
 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält oder
 wobei zwei benachbarte Reste R^9 gemeinsam einen ankondensierten
 Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen bedeuten, der carbocyclisch ist oder
 Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der
 unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe
 Halogen, $(C_1-C_4)Alkyl$ und Oxo substituiert ist,

Y^1, Y^2, Y^3 und weitere Gruppen Y^2 , wenn m 2, 3 oder 4 ist, jeweils unabhängig
 voneinander

- eine divalente Gruppe der Formel CR^aR^b , wobei R^a und R^b gleich
 oder verschieden sind und jeweils einen wie weiter unten
 definierten Rest bedeuten, oder
- eine divalente Gruppe der Formel -O-, -S-, -SO-, SO_2 , -CO-, -CS-,
 -CH(OR^*)-, -C(=NR⁺)-, -NR⁺- oder -N(O)-, wobei R^* Wasserstoff
 oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder
- Y^1 oder Y^3 eine direkte Bindung,

wobei zwei Sauerstoffatome der Gruppen Y^1 bis Y^3 nicht benachbart sind,
 R^a, R^b Wasserstoff, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, Aminocarbonyl, $(C_1-C_4)Alkyl$, Cyano-(C_1-C_4)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylamino$, Di-[$(C_1-C_4)alkyl$]-amino, Halo-(C_1-C_4)alkyl, Hydroxy-(C_1-C_4)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, Halo(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl, $(C_1-C_4)Alkylthio$, Halo-(C_1-C_4)alkylthio, (C_2-C_6)Alkenyl, Halo-(C_2-C_6)Alkenyl, (C_2-C_6)Alkinyl, Halo-(C_2-C_6)alkinyl, (C_1-C_4)Alkylamino-(C_1-C_4)alkyl, Di-[$(C_1-C_4)alkyl$]-amino-(C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_9)Cycloalkylamino-(C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_9)Cyclo-alkyl, Heterocyclyl-(C_1-C_4)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen
 Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen
 oder mehrere aus der Gruppe (C_1-C_4)Alkyl, Halogen und Cyano
 substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl,
 Phenoxy carbonyl, Phenylcarbonyl-(C_1-C_4)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$ -carbonyl-(C_1-C_4)alkyl, $(C_1-C_4)Alkylamino$ -carbonyl-(C_1-C_4)alkyl, $(C_1-C_4)Alkyl$ -

carbonyl, (C_1 - C_4)Alkoxy-carbonyl, Mono- oder Di-[(C_1 - C_4)Alkyl]-amino-carbonyl, Phenoxy-(C_1 - C_4)alkyl, Phenyl-(C_1 - C_4)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocycloxy, Heterocyclthio oder einen der letztgenannten 17 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C_1 - C_4)Alkyl, (C_1 - C_4)Alkoxy, (C_1 - C_4)Alkylthio, (C_1 - C_4)Haloalkyl, (C_1 - C_4)Haloalkoxy, Formyl, (C_1 - C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1 - C_4)Alkoxy-carbonyl und (C_1 - C_4)Alkoxy substituiert ist,

wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält und

m 0, 1, 2, 3 oder 4,

n 0, 1, 2, 3 oder 4

bedeuten.

4. Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß

R^1 , R^2 unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl, (C_1 - C_4)Alkyl, (C_1 - C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1 - C_4)Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl oder

R^1 und R^2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^1R^2 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1 - C_4)Alkyl und Oxo substituiert ist,

R^3 Wasserstoff, Carboxy, Cyano, (C_1 - C_8)Alkyl, Cyano-(C_1 - C_4)alkyl, Halo-(C_1 - C_4)alkyl, Hydroxy-(C_1 - C_4)alkyl, (C_1 - C_4)Alkoxy-(C_1 - C_4)alkyl, Halo-(C_1 - C_4)alkoxy-(C_1 - C_4)alkyl, (C_2 - C_6)Alkenyl, Halo-(C_2 - C_6)Alkenyl, (C_1 - C_4)Alkylamino-(C_1 - C_4)alkyl, Di-[(C_1 - C_4)alkyl]-amino-(C_1 - C_4)alkyl, (C_3 - C_9)Cycloalkylamino-(C_1 - C_4)alkyl, (C_3 - C_9)Cycloalkyl, (C_3 - C_9)Cycloalkyl-(C_1 - C_4)alkyl, Heterocyclyl-(C_1 - C_4)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 4

Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C_1 - C_4)Alkyl und Halogen substituiert sind, oder Phenyl, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C_1 - C_4)alkyl, (C_1 - C_4)Alkoxy-carbonyl-(C_1 - C_4)alkyl, (C_1 - C_4)Alkylamino-carbonyl-(C_1 - C_4)alkyl, (C_1 - C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1 - C_4)Alkoxy-carbonyl, Phenoxy-(C_1 - C_4)alkyl, Phenyl-(C_1 - C_4)alkyl, Heterocyclyl, oder einen der letztgenannten 10 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, (C_1 - C_4)Alkyl, (C_1 - C_4)Alkoxy, (C_1 - C_4)Haloalkyl, (C_1 - C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1 - C_4)Alkoxy-carbonyl, (C_1 - C_4)Alkoxy, substituiert ist,

wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 7 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält,

R^4 Wasserstoff, Amino, Formyl, Aminocarbonyl, (C_1 - C_4)Alkyl, Cyano-(C_1 - C_4)alkyl, (C_1 - C_4)Alkylamino, (C_1 - C_4)Alkoxy-(C_1 - C_4)alkyl, (C_2 - C_6)Alkenyl, Halo-(C_2 - C_6)alkenyl, (C_2 - C_6)Alkinyl, Phenyl, (C_1 - C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1 - C_4)Alkoxy-carbonyl, Phenoxy-(C_1 - C_4)alkyl, Phenyl-(C_1 - C_4)alkyl, oder einen der letztgenannten 5 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1 - C_4)Alkyl, (C_1 - C_4)Alkoxy substituiert ist,

R^5 Wasserstoff, (C_1 - C_4)Alkyl, (C_2 - C_6)Alkenyl oder (C_2 - C_6)Alkinyl,

R^6 wenn $n = 1$ ist, und die Reste R^6 , jeweils unabhängig voneinander, wenn n größer als 1 ist, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, (C_1 - C_4)Alkyl, Cyano-(C_1 - C_4)alkyl, (C_1 - C_4)Alkoxy, (C_1 - C_4)Alkylamino, Halo-(C_1 - C_4)alkyl, Hydroxy-(C_1 - C_4)alkyl, (C_1 - C_4)Alkoxy-(C_1 - C_4)alkyl, (C_2 - C_6)Alkenyl, (C_2 - C_6)Alkinyl, (C_1 - C_4)Alkylamino-(C_1 - C_4)alkyl oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl oder einen der letztgenannten 3 Reste, der durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1 - C_4)Alkyl und (C_1 - C_4)Alkoxy substituiert ist,

Y^1 eine direkte Bindung oder CH_2 ,

- $(Y^2)_m$ einen divalenten Rest der Formel $-CH_2-$, $-CH(CH_3)-$, $-C(CH_3)_2-$, $-CH_2CH_2-$,
 $-CH(CH_3)-CH_2-$, $-CH(CH_3)-CH(CH_3)-$, $-CH_2CH(CH_3)-$, $-CH(C_6H_5)-CH_2-$,
 $-CH_2CH(C_6H_5)-$ oder $-CH(CH_3)-CH(C_6H_5)-$,
- Y^3 eine direkte Bindung oder einen divalenten Rest der Formel CH_2 ,
 $-CH(CH_3)-$, $-C(CH_3)_2-$, $CH(OH)$, $-O-$, $-S-$, CO , SO_2 , NH , $N(CH_3)$, $N(C_2H_5)$,
 $N(n-C_3H_7)$, $N(i-C_3H_7)$, $N(n-C_4H_9)$, $N(i-C_4H_9)$, $N(s-C_4H_9)$, $N(t-C_4H_9)$,
 $N(C_6H_5)$ oder $N(CH_2C_6H_5)$ und
- n 0, 1, 2 oder 3 bedeuten.

5. Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß
 R^1 , R^2 unabhängig voneinander Wasserstoff oder $(C_1-C_4)Alkyl$ oder
 R^1 und R^2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^1R^2 einen gesättigten heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N und O ausgewählt ist,

- R^3 $(C_1-C_8)Alkyl$, Cyano- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Haloalkyl$, Hydroxy- $(C_1-C_4)alkyl$,
 $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, Halo $(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_2-C_6)Alkenyl$, Halo- $(C_2-C_6)Alkenyl$, $(C_1-C_4)Alkylamino-(C_1-C_4)alkyl$, Di-[$(C_1-C_4)alkyl$]-amino- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_3-C_9)Cycloalkylamino-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_3-C_9)Cycloalkyl$, $(C_3-C_9)Cycloalkyl-(C_1-C_4)alkyl$, gesättigtes Heterocyclyl- $(C_1-C_4)alkyl$, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 4 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe $(C_1-C_4)Alkyl$ und Halogen substituiert sind, oder Phenyl, Phenylcarbonyl- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkylamino-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl$, Phenoxy- $(C_1-C_4)alkyl$, Phenyl- $(C_1-C_4)alkyl$, Heterocyclyl, oder einen der letztgenannten 7 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Haloalkyl$, $(C_1-C_4)Alkyl-carbonyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl$ und $(C_1-C_4)Alkoxy$ substituiert ist,

wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 7 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält,

R^4 Wasserstoff, Amino, Formyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkyl, Cyano- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, Halo- (C_2-C_6) alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Phenyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, oder einen der letztgenannten 5 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy substituiert ist,

R^5 Wasserstoff oder (C_1-C_4) Alkyl,

R^6 wenn $n = 1$ ist, und die Reste R^6 , jeweils unabhängig voneinander, wenn n größer als 1 ist, Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy oder Halo- (C_1-C_4) alkyl,

Y^1 eine direkte Bindung oder CH_2 ,

$(Y^2)_m$ einen divalenten Rest der Formel CH_2 oder CH_2CH_2 ,

Y^3 eine direkte Bindung, CH_2 , -O- oder -S-,

n 0, 1, 2 oder 3

bedeuten.

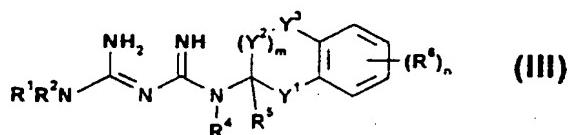
6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (II) oder deren Salze, wie sie in einem der Ansprüche 1 bis 5 definiert sind, dadurch gekennzeichnet, daß man

a) eine Verbindung der Formel (II),



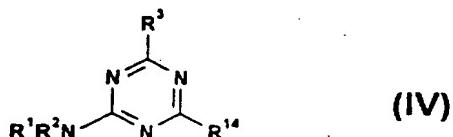
worin R^{13} eine funktionelle Gruppe aus der Gruppe Carboxy und Derivate der Carboxygruppe bedeutet,

mit einem Biguanidid der Formel (III) oder einem Säureadditionssalz hiervon



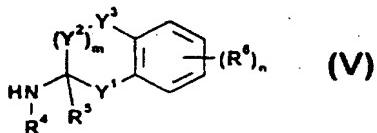
umsetzt oder

- b) eine Verbindung der Formel (IV),



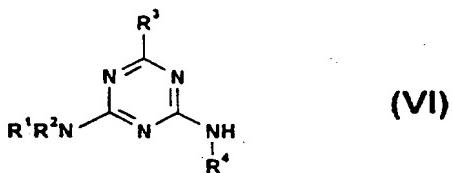
worin R^{14} einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe bedeutet,

mit einem geeigneten Amin der Formel (V) oder einem Säureadditionssalz hiervon

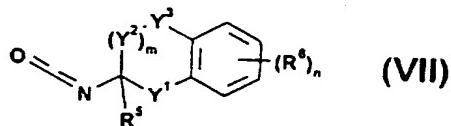


umsetzt oder

- c) ein Diamino-1,3,5-triazin der Formel (VI)



mit einem Isocyanat der Formel (VII)



umsetzt,

wobei in den Formeln (II), (III), (IV), (V), (VI) und (VII) die Reste R¹, R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ sowie Y¹, Y², Y³, m und n wie in Formel (I) definiert sind.

7. Herbizides oder pflanzenwachstumsregulierende Mittel, dadurch gekennzeichnet, daß es mindestens eine Verbindung der Formel (I) oder deren Salz nach einem der Ansprüche 1 bis 5 und im Pflanzenschutz übliche Formulierungshilfsmittel enthält.
8. Verfahren zur Bekämpfung vor Schadpflanzen oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man eine wirksame Menge von mindestens einer Verbindung der Formel (I) oder deren Salz nach einem der Ansprüche 1 bis 5 auf die Pflanzen, Pflanzensamen oder die Anbaufläche appliziert.
9. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze nach einem der Ansprüche 1 bis 5 als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren.
10. Verbindungen der Formel (V) oder (VII), wie sie in Anspruch 6 definiert sind.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 97/00702

| | | |
|-------------------------------------|---|-----------------------|
| A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER | IPC 6 C07D251/18 A01N43/68 C07D405/06 C07D409/12 C07D251/52 | C07D405/12 C07D413/04 |
|-------------------------------------|---|-----------------------|

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|----------|---|-----------------------|
| A | EP 0 283 522 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) 28 September 1988 cited in the application see claims | 1,7 |
| A | US 3 816 419 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 11 June 1974 cited in the application see claims | 1,7 |
| A | EP 0 509 544 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) 21 October 1992 cited in the application see claims | 1,7 |
| | --- | |
| | -/- | |

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *&* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

3 June 1997

Date of mailing of the international search report

12.06.97

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+ 31-70) 340-3016

Authorized officer

Van Bijlen, H

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

| | |
|-----------------|--------------------|
| Inte | nal Application No |
| PCT/EP 97/00702 | |

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|------------|--|-----------------------|
| P,X | <p>CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 125, no. 17, 21 October 1996 Columbus, Ohio, US; abstract no. 221878, KUBOTA,MINEYUKI ET AL: "Triazine derivatives as active agents in herbicides" XP002032242 RN 181424-18-0, -12-4, -08-8, -05-5 ; 181423-74-5, -68-7, -62-1, -56-3, -49-4, 43-8, -37-0, -31-4, -26-7, -20-1, -08-5, -01-8 ; 181422-95-7, -91-3, -87-7, -80-0, - see abstract & JP 96 183 781 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) ---</p> | 1,7,10 |
| P,A | <p>WO 97 00254 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 3 January 1997 see claims -----</p> | 1,7 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

Inter
nal Application No
PCT/EP 97/00702

| Patent document cited in search report | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
|---|---------------------|--|----------------------------------|
| EP 283522 A | 28-09-88 | WO 8802368 A JP 7010861 B US 4932998 A | 07-04-88 08-02-95 12-06-90 |
| US 3816419 A | 11-06-74 | US 3932167 A | 13-01-76 |
| EP 509544 A | 21-10-92 | JP 5320145 A US 5250686 A | 03-12-93 05-10-93 |
| WO 9700254 A | 03-01-97 | DE 19522137 A AU 6301296 A | 02-01-97 15-01-97 |

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 97/00702

| | | | | | |
|--|------------|------------|------------|------------|------------|
| A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES | | | | | |
| IPK 6 | C07D251/18 | A01N43/68 | C07D405/06 | C07D409/12 | C07D251/52 |
| | C07D405/12 | C07D413/04 | | | |

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationsymbole)
IPK 6 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|---|--------------------|
| A | EP 0 283 522 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) 28.September 1988 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche --- | 1,7 |
| A | US 3 816 419 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 11.Juni 1974 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche --- | 1,7 |
| A | EP 0 509 544 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) 21.Oktober 1992 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche --- | 1,7 |
| | -/- | |

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

- * Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
- *'A' Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- *'E' älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- *'L' Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- *'O' Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- *'P' Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

- *'T' Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- *'X' Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfundenischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- *'Y' Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfundenischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- *'&' Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

3.Juni 1997

12.06.97

Name und Postanschrift der Internationale Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.
Fax (+ 31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Van Bijlen, H

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

| | |
|-----------------|--------------------|
| Inte | nales Aktenzeichen |
| PCT/EP 97/00702 | |

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|--|--------------------|
| P,X | <p>CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 125, no. 17, 21.Oktober 1996 Columbus, Ohio, US; abstract no. 221878, KUBOTA,MINEYUKI ET AL: "Triazine derivatives as active agents in herbicides" XP002032242 RN 181424-18-0, -12-4, -08-8, -05-5 ; 181423-74-5, -68-7, -62-1, -56-3, -49-4, 43-8, -37-0, -31-4, -26-7, -20-1, -08-5, -01-8 ; 181422-95-7, -91-3, -87-7, -80-0,</p> <p>siehe Zusammenfassung & JP 96 183 781 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD)</p> <p>---</p> | 1,7,10 |
| P,A | <p>WO 97 00254 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 3.Januar 1997 siehe Ansprüche</p> <p>-----</p> | 1,7 |

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 97/00702

| Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument | Datum der Veröffentlichung | Mitglied(er) der Patentfamilie | Datum der Veröffentlichung |
|---|----------------------------|--|----------------------------------|
| EP 283522 A | 28-09-88 | WO 8802368 A JP 7010861 B US 4932998 A | 07-04-88 08-02-95 12-06-90 |
| US 3816419 A | 11-06-74 | US 3932167 A | 13-01-76 |
| EP 509544 A | 21-10-92 | JP 5320145 A US 5250686 A | 03-12-93 05-10-93 |
| WO 9700254 A | 03-01-97 | DE 19522137 A AU 6301296 A | 02-01-97 15-01-97 |

THIS PAGE BLANK (USPTO)